

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2001年7月5日 (05.07.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/47883 A1

(51) 国際特許分類: C07D 209/12, 235/18, 235/30, 401/04, 401/10, 401/12, 401/14, 403/12, 405/04, 405/12, 409/04, 409/12, 409/14, 413/04, 413/12, 417/12, 471/04, 487/04, A61K 31/407, 31/4178, 31/4184, 31/422, 31/427, 31/428, 31/433, 31/437, 31/4439, 31/454, 31/4709, 31/4725, 31/496, 31/498, 31/506, 31/53, 31/5377, 31/541, 31/55, A61P 1/16, 31/20

[JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒541-0046 大阪府大阪市中央区平野町三丁目3番9号 湯木ビル Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/09181

(22) 国際出願日: 2000年12月22日 (22.12.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願平 11-369008
1999年12月27日 (27.12.1999) JP

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8422 東京都港区虎ノ門2丁目2番1号 Tokyo (JP).

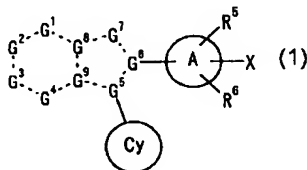
添付公開書類:
— 国際調査報告書

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 橋本宏正 (HASHIMOTO, Hiromasa) [JP/JP]. 水谷憲二 (MIZUTANI, Kenji) [JP/JP]. 吉田厚仁 (YOSHIDA, Atsuhito)

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: FUSED-RING COMPOUNDS AND USE THEREOF AS DRUGS

(54) 発明の名称: 縮合環化合物及びその医薬用途



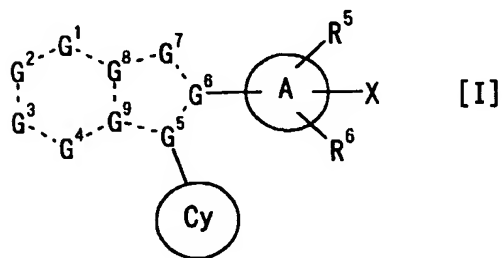
(57) Abstract: Fused-ring compounds represented by general formula [I] or the like, or pharmaceutically acceptable salts thereof; and hepatitis C remedies containing the compounds or salts: [I] (wherein each symbol is as defined in the description). The above compounds and salts exhibit an anti-HCV (hepatitis C virus) activity by virtue of their inhibitory activity against HCV polymerase, thus being useful as therapeutic or preventive agents for hepatitis C.

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、下記一般式[I]



(式中、各記号は明細書に記載の通りである。) 等で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及びそれら化合物を含有してなる C 型肝炎治療剤に関する。本発明の化合物は、C 型肝炎ウイルス (HCV) ポリメラーゼ阻害作用により抗 HCV 作用を示し、C 型肝炎の治療剤又は予防剤として有用である。

明細書

縮合環化合物及びその医薬用途

技術分野

本発明は、C型肝炎治療剤として有用な新規な縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩に関する。また本発明は、ある種の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩のC型肝炎治療剤としての新規な用途に関する。更に詳しくは、抗C型肝炎ウイルス（HCV）作用、特にRNA依存性RNAポリメラーゼ阻害活性により抗HCV作用を示すC型肝炎の予防若しくは治療に有効な縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を含むC型肝炎治療剤に関する。

背景技術

1989年、輸血後の非A非B型肝炎の主要な原因ウイルスが発見されC型肝炎ウイルス（HCV）と名づけられた。現在では、A型、B型、C型の他、数種の肝炎ウイルスが発見されており、HCVにより引き起こされる肝炎がC型肝炎と呼ばれている。

HCV感染患者は全世界人口の数%にも及ぶと推定されており、その感染は長期慢性化する特徴を有する。

HCVは、エンベロープを有するRNAウイルスであり、ゲノムは一本鎖プラス鎖RNAで、フラビウイルス科のHepacivirus属に分類される（International Union of Microbiological Societies のThe International Committee on Taxonomy of Virusesより）。例えば同じ肝炎ウイルスであっても、DNAウイルスであるB型肝炎ウイルス（HBV）は、免疫能の未熟な新生児、乳幼児期以外では、たとえ感染しても免疫機構により排除され急性感染で終わる。それと比較し、HCVは、未だ明らかではない原因により宿主の免疫機構を回避するため、免疫機構の発達した大人に感染した場合でも持続感染に移行することが多い。

HCVの持続感染に伴い慢性肝炎が引き起こされると、その後、高率に肝硬変、肝癌へと進行し、手術で癌を摘出しても、非癌部で引き続き起こる炎症のため肝癌が再発する患者も多いことが知られている。

よって、C型肝炎の有効な治療方法の確立が望まれており、その中でも、抗炎症剤により炎症を抑える対症療法とは別に、炎症が引き起こされない程度にHC

Vを減らす或いはHCVを根絶させる薬剤の開発が強く望まれている。

現在、HCV排除の唯一有効な治療法としてインターフェロン治療が知られている。しかし、インターフェロンによりウイルスを排除できる人は、全患者の1/3程度であり、残りの人には全く効かない、若しくは一時的な効果しか見られないことが知られている。従って、インターフェロンに代わり用いられる若しくはそれと併用される抗HCV薬への期待は大きい。

近年、リバビリン(Ribavirin: 1- β -D-リボフラノシル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド)がインターフェロンとの併用によるC型肝炎治療剤として市販されているが、インターフェロンの有効性を高めはするものの、依然有効率は低く、更なる新規なC型肝炎治療剤が望まれている。

また、インターフェロンアゴニスト、インターロイキン-12アゴニスト等、患者自身の免疫力を増強させウイルスを排除する手段も試みられているが、未だ有効とされる薬剤は見出されていない。

また近年、HCV特異的なタンパク質をターゲットとしたHCV増殖阻害にも注目が集まっている。

HCV自身の遺伝子にはセリンプロテアーゼ、RNAヘリカーゼ、RNA依存性RNAポリメラーゼ等のタンパク質がコードされており、それらタンパク質はHCVの増殖に必須の特異的タンパク質として機能する。

特異的タンパク質の一つであるRNA依存性RNAポリメラーゼ(以後単にHCVポリメラーゼとも言う。)は、ウイルス増殖に必須の酵素である。プラス鎖RNA遺伝子を持つHCVの遺伝子複製は、まずプラス鎖RNAを鋳型にして、相補的なマイナス鎖RNAを合成し、さらにそのマイナス鎖RNAを鋳型にしてプラス鎖RNAを増幅するという手順によると考えられている。HCVのコードするタンパク質前駆体のNS5Bと呼ばれる部位が、RNA依存性RNAポリメラーゼ活性を示すことが示されており(EMBO J., 15, 12-22, 1996)、HCV遺伝子複製の中心的役割を果たすと考えられている。

よって、HCVポリメラーゼの阻害剤は、抗HCV薬開発のターゲットとなり得、その開発への期待は高い。しかし、その他の作用機序による抗HCV薬の開

発と同様、未だ有効なHCVポリメラーゼ阻害剤の開発には至っておらず、未だC型肝炎を治療できる薬剤は不十分である。

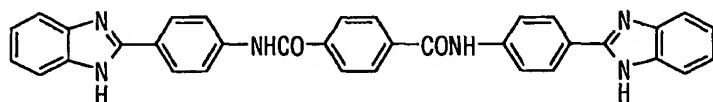
次に本発明に比較的類似の既知化合物について述べる。

ベンゾイミダゾール骨格を有するC型肝炎治療剤としては、WO97/36866号、特表2000-511899号(E P 906097号)、WO99/51619号が公知である。

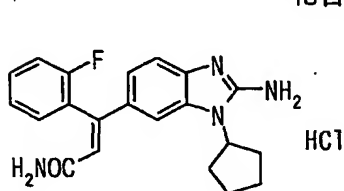
WO97/36866号には下記化合物D等が開示されており、該化合物のHCVヘリカーゼ阻害活性について記載されている。

特表2000-511899号(E P 906097号)には下記化合物E等が、また、WO99/51619号には下記化合物F等が開示されており、両者ともにHCV阻害剤として有効な可能性が述べられている。

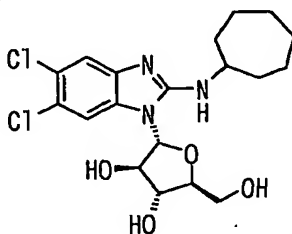
しかし、これら公報には本発明明細書中に開示の化合物は含まれず、またそれを示唆する記載も見られない。



化合物D



化合物E

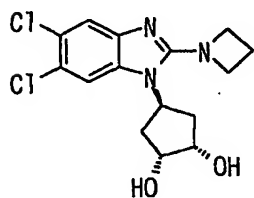


化合物F

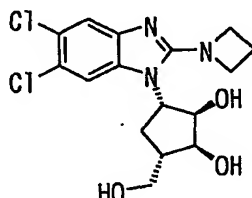
ベンゾイミダゾール骨格を有する抗肝炎ウイルス剤としては、特表2000-503017号(WO97/25316号)及び特表平10-505092号(WO96/7646号)が公知である。

WO97/25316号には下記化合物A等が開示されており、その用途としてウイルス感染の治療が述べられている。また、対象となるウイルスとしてB型肝炎ウイルス等のDNAウイルスが挙げられている。しかし、当該公報には本発明明細書中に開示の化合物は含まれず、かつHCVに関する記載はなく、またそれを示唆する記載も見られない。

特表平10-505092号には下記化合物B等が開示されており、その用途としてウイルス感染の治療が述べられている。また、対象となるウイルスとしてDNAウイルスであるヘルペスウイルス及びB型肝炎ウイルスが記載されている。しかし、当該公報にも本発明明細書中に開示の化合物は含まれず、かつHCVに関する記載、またそれを示唆する記載も見られない。



化合物A



化合物B

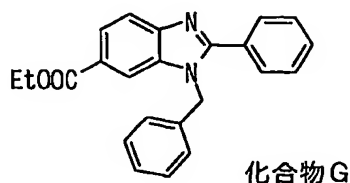
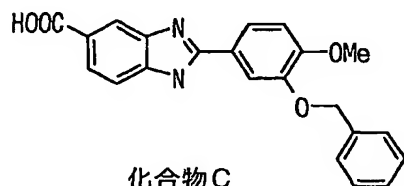
抗ウイルス活性を有するベンゾイミダゾール誘導体は、特開平3-31264号、US3644382号及びUS3778504号にも記載されている。また、WO98/37072号には腫瘍壊死因子(TNF)及びサイクリックAMPの産生阻害物質として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗ヒト免疫不全ウイルス(HIV)剤及び抗炎症剤への利用が記載されている。また、WO98/05327号には逆転写酵素阻害剤として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗HIV剤への利用が記載されている。また、J. Med. Chem. (13(4), 697-704, 1970)にはノイラミニダーゼ阻害剤として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗インフルエンザウイルス剤への利用が記載されている。

しかし、何れの文献にも本発明化合物は含まれず、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載も見られない。

抗ウイルス剤以外の医薬用途を有するベンゾイミダゾール誘導体として、特開平8-501318号(US5824651号)及び特開平8-134073号(US5563243号)が公知である。当該公報にはカテコールジェーテル化合物として下記化合物C等が開示されており、抗炎症剤としての使用について記載されている。しかし、両公報ともに本発明化合物を含まず、その作用機序としては、前者にはホスホジエステラーゼIVが、後者にはTNFが記載されているのみであり、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載は見られない。

また、特表2000-159749号(EP882718号)には、下記化合

物G等が開示されており、気管支炎、腎炎等への治療用途が記載されている。しかし、当該公報は本発明化合物を含まず、ホスホジエステラーゼI V阻害及び血糖降下活性が記載されているのみであり、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載は見られない。



また、WO 98/50029号、WO 98/50030号及びWO 98/50031号には、プロテインイソプレニル転移酵素作用を有する抗癌剤としてベンゾイミダゾール誘導体が記載されている。当該公報には、広範な請求の範囲が記載されるが、少なくとも本発明化合物と類似する化合物は記載されておらず、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載も見られない。

また、特開平8-109169号（EP 694535号）にはタキキニン受容体拮抗物質の炎症性疾患への適用が、WO 96/35713号には成長ホルモン放出促進剤としての骨粗鬆症等の成長ホルモン関連疾患への適用が記載されている。しかし、何れの公報にも抗HCV作用に関する記載はなく、それを示唆する記載も見られない。

医薬用途以外にも特開昭53-14735号には、光沢剤としてベンゾイミダゾール誘導体が記載されてはいるが、これも本発明化合物を包含するものではない。

発明の開示

これまでの研究で得られた知見により、抗HCV作用を有する薬剤は、C型肝炎の予防及び治療に有効であり、特にHCVの有するRNA依存性RNAポリメラーゼ阻害作用を有する抗HCV剤は有効なC型肝炎の予防及び治療剤、またC型肝炎に起因する疾患の予防及び治療剤に成り得ることが明らかとなった。

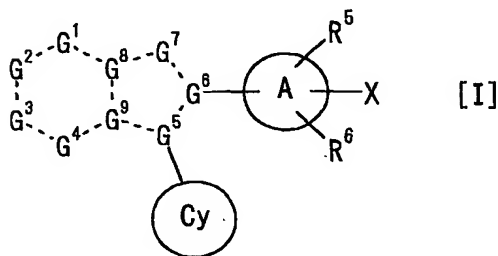
従って、本発明は、抗HCV作用を有する薬剤、特にRNA依存性RNAポリメラーゼ阻害作用を有する薬剤を提供することを課題とする。

本発明者らは、抗HCV作用、特にRNA依存性RNAポリメラーゼ阻害作用

を有する化合物を見出すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明を完成するに至った。

より詳しくは下記(1)乃至(43)に示す通りである。

(1) 下記一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成るC型肝炎治療剤。



[式中、破線は単結合又は二重結合であり、

G^1 は、 $C(-R^1)$ 又は窒素原子であり、

G^2 は、 $C(-R^2)$ 又は窒素原子であり、

G^3 は、 $C(-R^3)$ 又は窒素原子であり、

G^4 は、 $C(-R^4)$ 又は窒素原子であり、

G^5 、 G^6 、 G^8 及び G^9 は、それぞれ独立して、炭素原子又は窒素原子であり、

G^7 は、 $C(-R^7)$ 、酸素原子、硫黄原子、又は R^8 で置換されてもよい窒素原子であり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)C1-6アルカノイル基、

(3)カルボキシ基、

(4)シアノ基、

(5)ニトロ基、

(6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシカルボニル基及びC1-6アルキルアミノ基。

(7)-COOR^{al}、

ここでR^{al}は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は下

記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

グループB；ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 r は0又は1乃至6の整数である。

(8) $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで R^{a2} 及び R^{a3} は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9) $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで R^{a4} は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10) $-NHR^{a5}$ 、

ここで R^{a5} は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11) $-OR^{a6}$ 、

ここで R^{a6} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12) $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで R^{a7} は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

又は、

(13) $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

であり、

R^7 及び R^8 は、水素原子又は置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）であり、

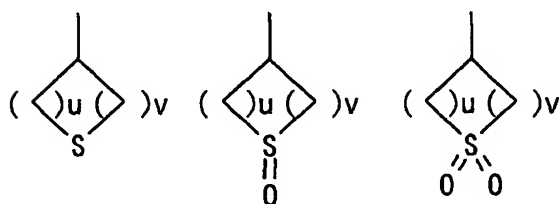
環 Cy は、

(1) 下記グループ C から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、

グループ C ; 水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及び C1-6アルコキシ基。

(2) 前記グループ C から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルケニル基又は、

(3)



（式中、u 及び v は、それぞれ独立して 1 乃至 3 の整数を表す。）であり、
環 A は、

(1) C6-14アリール基、

(2) C3-8シクロアルキル基、

(3) C3-8シクロアルケニル基、又は、

(4) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

R^5 及び R^6 は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

(3) 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4) $-OR^{a8}$

ここで R^{a8} は、水素原子、C1-6アルキル基又は C6-14アリール C1-6アルキル基を意味する。

であり、

Xは、

- (1)水素原子、
- (2)ハロゲン原子、
- (3)シアノ基、
- (4)ニトロ基、
- (5)アミノ基、C1-6アルカノイルアミノ基、
- (6)C1-6アルキルスルホニル基、
- (7)置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (8)前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC2-6アルケニル基、
- (9) $-COOR^{a9}$ 、

ここで R^{a9} は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

- (10) $-CONH-(CH_2)_1-R^{a10}$ 、

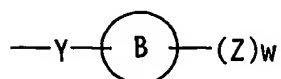
ここで R^{a10} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、C1-6アルコキシカルボニル基又はC1-6アルカノイルアミノ基であり、1は、0又は1乃至6の整数を意味する。

- (11) $-OR^{a11}$ 、

ここで R^{a11} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

又は、

- (12)



{式中、環Bは、

- (1') C6-14アリール基、
- (2') C3-8シクロアルキル基、又は、
- (3') ヘテロ環基（前記定義の通り。）であり、
- Zは、それぞれ独立して、
- (1') 下記グループDから選ばれる基、

(2') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、

(3') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、

(4') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基、又は、

(5') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

グループD：

(a)水素原子、

(b)ハロゲン原子、

(c)シアノ基、

(d)ニトロ基、

(e)置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(f) $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、tは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

ここで R^{a18} は、

(1'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(2'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、又は、

(3'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

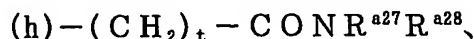
ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、

(g) $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで R^{a19} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基(前記定義の通り。)

又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a27} 及び R^{a28} は、それぞれ独立して、

(1'') 水素原子、

(2'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、

(4'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基、

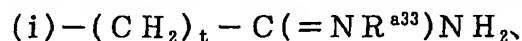
(5'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、

(6'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環 C1-6アルキル基、

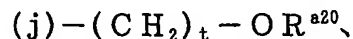
ここで当該ヘテロ環 C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6アルキル基を意味する。

(7'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、又は

(8'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル C1-6アルキル基であり、



ここで R^{a33} は、水素原子又は C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a20} は、

(1'') 水素原子、

(2'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'') 置換されてもよい C2-6アルケニル基（前記定義の通り。）、

(4'') 前記グループAから選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい

C2-6アルキニル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C6-14アリール基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C6-14アリールC1-6アルキル基、

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
ヘテロ環基、

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
ヘテロ環C1-6アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキル基、又は

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、

(k)-(CH₂)_t-O-(CH₂)_p-COR^{a21}、

ここでR^{a21}は、C1-6アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは0又は1乃至6の整数を意味する。

(l)-(CH₂)_t-NR^{a22}R^{a23}、

ここでR^{a22}及びR^{a23}は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C6-14アリール基、

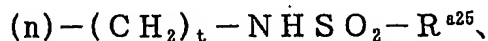
(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C6-14アリールC1-6アルキル基、又は、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
ヘテロ環C1-6アルキル基であり、

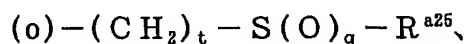
(m)-(CH₂)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}、

ここでR^{a29}は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

R^{a24} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

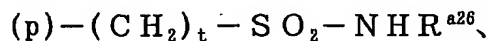


ここで R^{a25} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで R^{a25} は前記定義の通りであり、 q は0、1又は2である。

及び、



ここで R^{a26} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

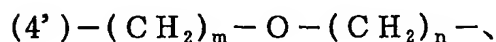
w は、1乃至3の整数であり、

Y は、

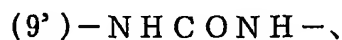
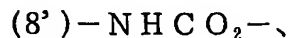
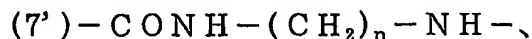
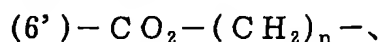
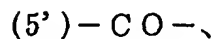
(1') 単結合、

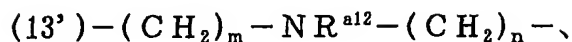
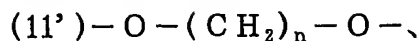
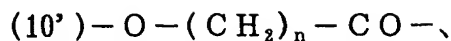
(2') C1-6アルキレン、

(3') C2-6アルケニレン、



以下、 m 及び n は、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。





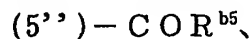
ここで R^{a12} は、

(1'')水素原子、

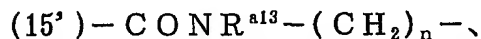
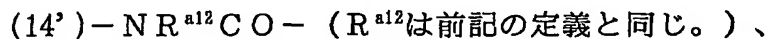
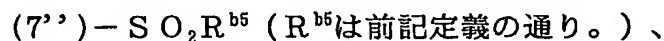
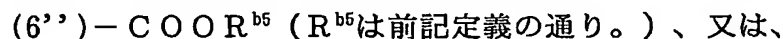
(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、



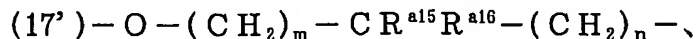
ここで R^{b5} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a14} は、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基を意味する。



ここで R^{a15} 及び R^{a16} は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')カルボキシ基、

(3'')C1-6アルキル基、

(4'')-OR^{b6}、

ここでR^{b6}は、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

又は、

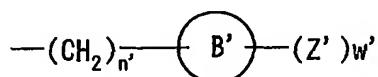
(5'')-NHR^{b7}

ここでR^{b7}は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR^{a15}は、

(6'')



であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18'')-(CH₂)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-(R^{a12}及びR^{a15}は、それぞれ前記定義の通り。)、

(19'')-NR^{a17}SO₂-

ここでR^{a17}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(20'')-S(O)_e-(CH₂)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH₂)_n-(eは0、1又は2であり、R^{a15}及びR^{a16}は、それぞれ前記定義の通り。)

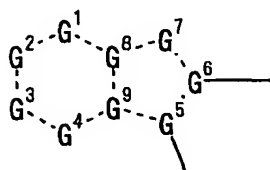
である。}である。]

(2) G¹、G²、G³、G⁴、G⁵、G⁶、G⁷、G⁸及びG⁹のうち1乃至4個が窒素原子である(1)記載のC型肝炎治療剤。

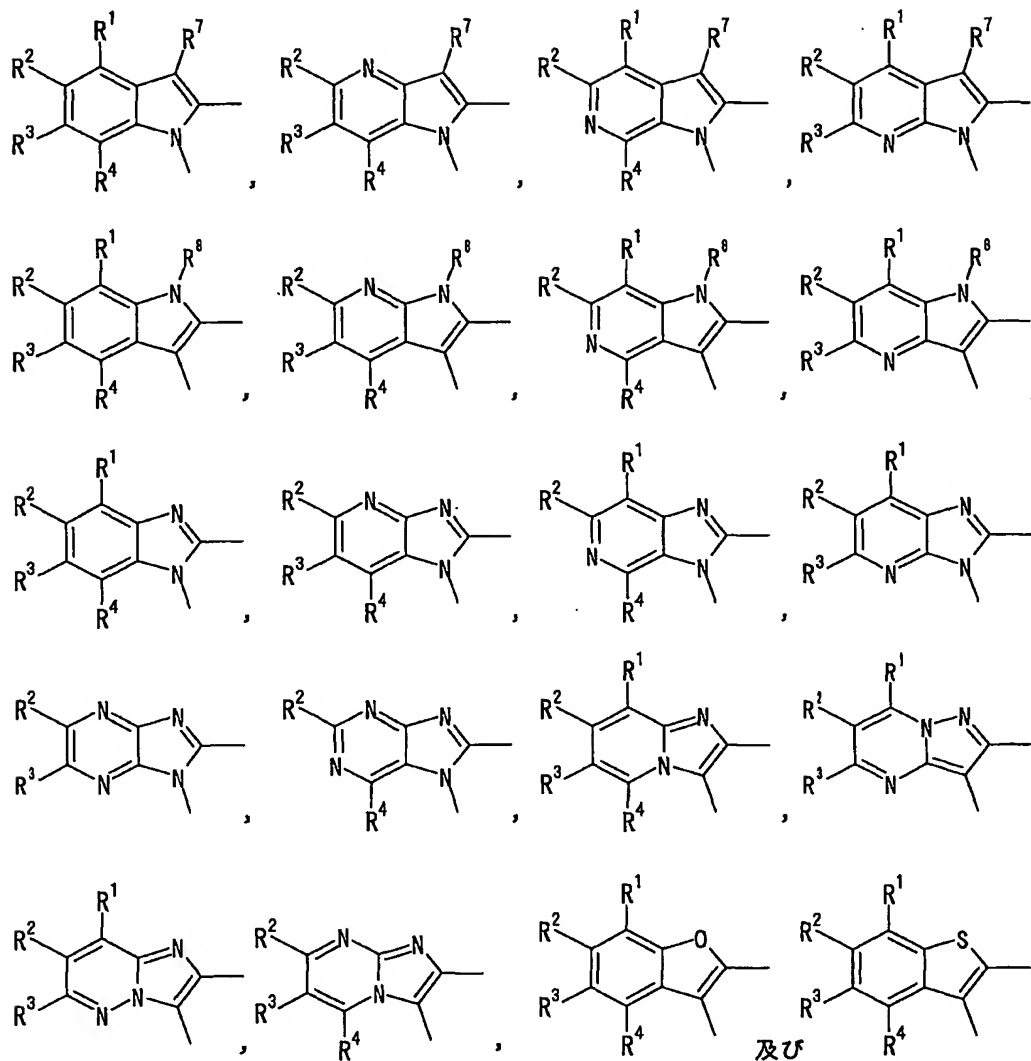
(3) G²がC(-R²)であり、G⁶が炭素原子である(2)記載のC型肝炎治療剤。

(4) G⁵が窒素原子である(2)又は(3)記載のC型肝炎治療剤。

(5) 一般式 [I] の

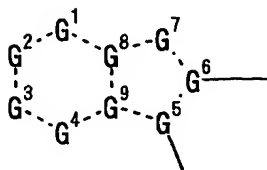


部位が、

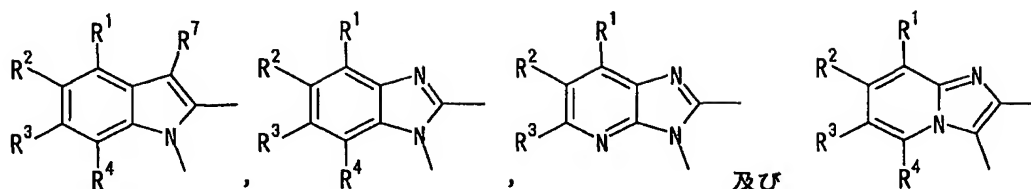


からなる群より選ばれる縮合環である (1) 記載の C 型肝炎治療剤。

(6) 一般式 [I] の

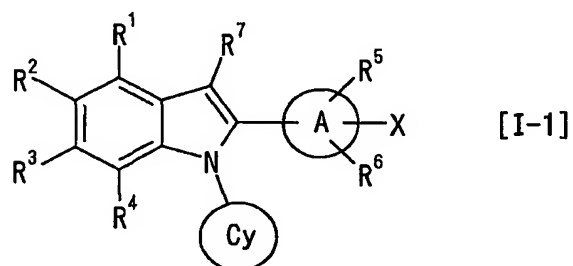


部位が、



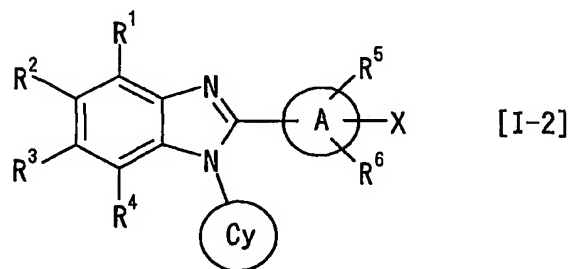
からなる群より選ばれる縮合環である（５）記載のＣ型肝炎治療剤。

（７）下記一般式〔Ｉ－１〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

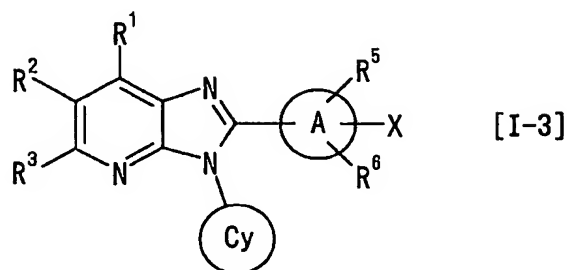
（８）下記一般式〔Ｉ－２〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

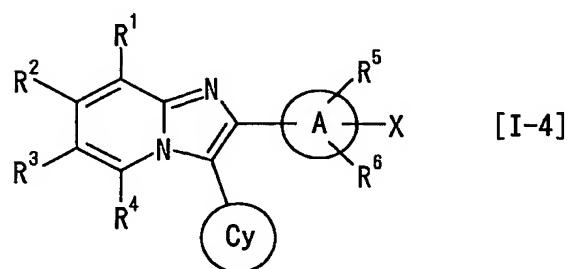
（９）下記一般式〔Ｉ－３〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその

塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

（１０）下記一般式〔Ｉ－４〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



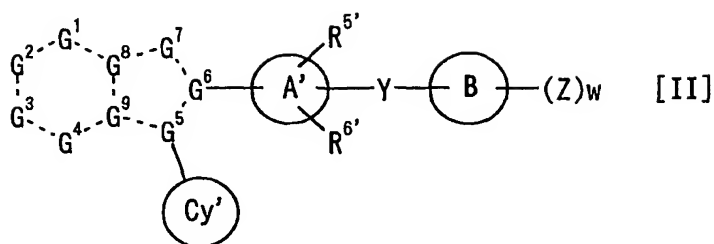
（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

（１１） R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも１つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 又は $-SO_2R^{a7}$ （ R^{a1} 、 R^{a2} 、 R^{a3} 及び R^{a7} は（１）記載の通りである。）である（１）乃至（１０）のいずれかに記載のＣ型肝炎治療剤。

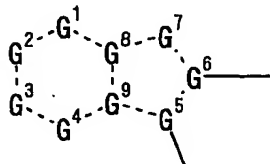
（１２）環Cyが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である（１）乃至（１１）のいずれかに記載のＣ型肝炎治療剤。

（１３）環Aが、C6-14アリール基である（１）乃至（１２）のいずれかに記載のＣ型肝炎治療剤。

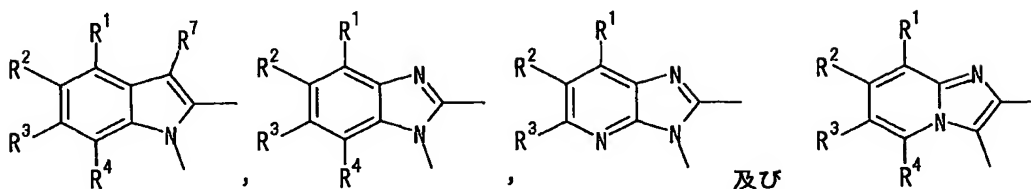
（１４）下記一般式〔II〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



[式中、



部位は、



からなる群より選ばれる縮合環であり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)C1-6アルカノイル基、

(3)カルボキシ基、

(4)シアノ基、

(5)ニトロ基、

(6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシカルボニル基及びC1-6アルキルアミノ基。

(7)-COOR^{al}、

ここでR^{al}は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリー

ルC1-6アルキル基を意味する。

グループB ; ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 r は0又は1乃至6の整数である。

(8) $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで R^{a2} 及び R^{a3} は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9) $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで R^{a4} は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10) $-NHR^{a5}$ 、

ここで R^{a5} は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11) $-OR^{a6}$ 、

ここで R^{a6} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12) $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで R^{a7} は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

又は、

(13) $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

であり、

R^7 は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）

であり、

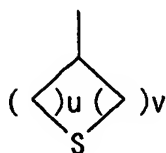
環C y' は、

(1) 下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基

グループC；水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。

又は、

(2)



(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、

環A' は、

(1) フェニル基、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれる基であり、

R^{6a} 及びR^{6b} は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

(3) 置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4) 水酸基

であり、

環Bは、

(1) C6-14アリール基、

(2) C3-8シクロアルキル基、又は、

(3) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

Zは、それぞれ独立して、

(1) 下記グループDから選ばれる基、

- (2)下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、
- (3)下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、
- (4)下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、又は、
- (5)下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

グループD：

- (a)水素原子、
- (b)ハロゲン原子、
- (c)シアノ基、
- (d)ニトロ基、
- (e)置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (f) $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、tは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

ここで R^{a18} は、

- (1')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (2')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、又は、
- (3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

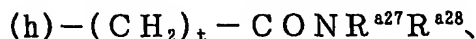
ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、

- (g) $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで R^{a19} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）

又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a27} 及び R^{a28} は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

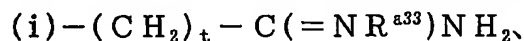
(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

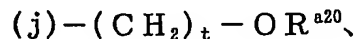
ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、又は

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、



ここで R^{a33} は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a20} は、

(1')水素原子、

(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3')置換されてもよいC2-6アルケニル基（前記定義の通り。）、

(4')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC

2-6アルキニル基、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリール基、

(6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリールC1-6アルキル基、

(7')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環基、

(8')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環C1-6アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキル基、又は

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、

(k)-(CH₂)_t-O-(CH₂)_p-COR^{a21}、

ここでR^{a21}は、C1-6アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至
5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは0又は1乃至6の整数
を意味する。

(l)-(CH₂)_t-NR^{a22}R^{a23}、

ここでR^{a22}及びR^{a23}は、それぞれ独立して、

(1')水素原子、

(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリール基、

(4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリールC1-6アルキル基、又は、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環C1-6アルキル基であり、

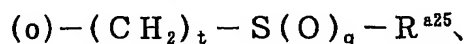
(m)-(CH₂)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}、

ここでR^{a29}は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

R^{a24} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

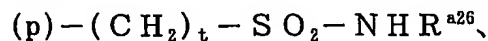


ここで R^{a25} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで R^{a25} は前記定義の通りであり、 q は0、1又は2である。

及び、



ここで R^{a26} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

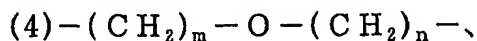
w は、1乃至3の整数であり、

Y は、

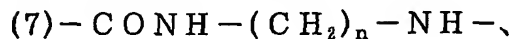
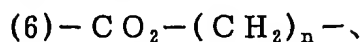
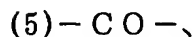
(1)単結合、

(2)C1-6アルキレン、

(3)C2-6アルケニレン、



以下、 m 及び n は、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。



(10) $-O-(CH_2)_n-CO-$ 、

(11) $-O-(CH_2)_n-O-$ 、

(12) $-SO_2-$ 、

(13) $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、

ここで R^{a12} は、

(1') 水素原子、

(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(4') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(5') $-COR^{b5}$ 、

ここで R^{b5} は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(6') $-COOR^{b5}$ (R^{b5} は前記定義の通り。)、又は、

(7') $-SO_2R^{b5}$ (R^{b5} は前記定義の通り。)、

(14) $-NR^{a12}CO-$ (R^{a12} は前記の定義と同じ。)、

(15) $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、

ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(16) $-CONH-CHR^{a14}-$ 、

ここで R^{a14} は、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基を意味する。

(17) $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 、

ここで R^{a15} 及び R^{a16} は、それぞれ独立して、

(1') 水素原子、

(2')カルボキシル基、

(3')C1-6アルキル基、

(4')-OR^{b6}、

ここでR^{b6}は、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

又は、

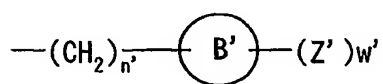
(5')-NHR^{b7}

ここでR^{b7}は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR^{a16}は、

(6')



であつてもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なつてもよい。

(18)-(CH₂)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-(R^{a12}及びR^{a15}は、それぞれ前記定義の通り。)、

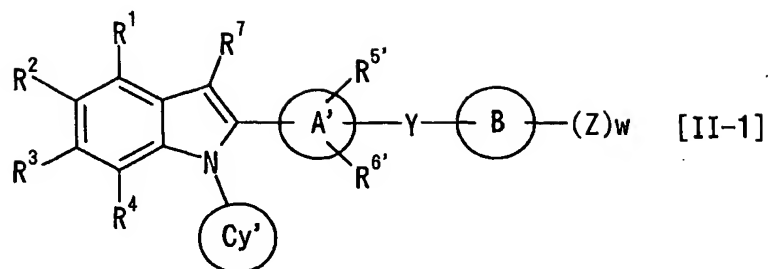
(19)-NR^{a17}SO₂-、

ここでR^{a17}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

又は、

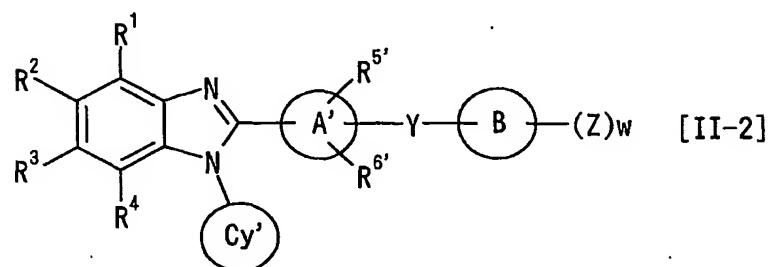
(20)-S(O)_e-(CH₂)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH₂)_n-(eは0、1又は2であり、R^{a15}及びR^{a16}は、それぞれ前記定義の通り。)である。]

(15) 下記一般式[II-1]で表される(14)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



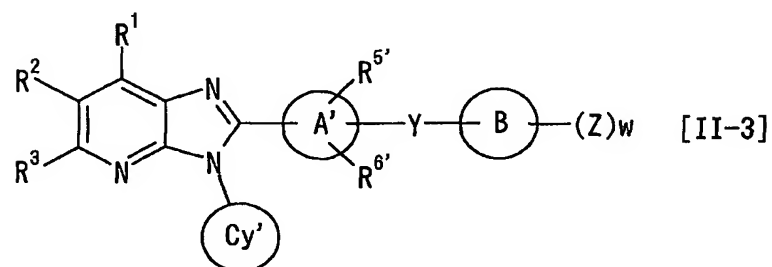
(式中、各記号は(14)記載の通りである。)

(16) 下記一般式 [II-2] で表される(14)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



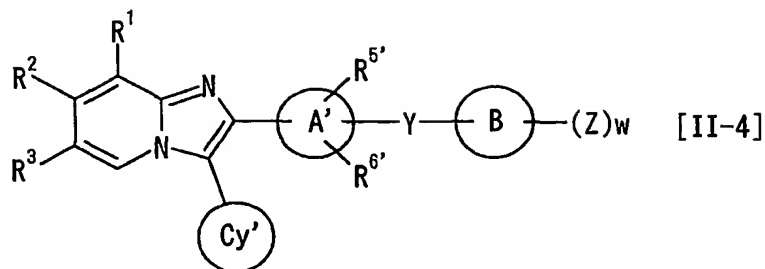
(式中、各記号は(14)記載の通りである。)

(17) 下記一般式 [II-3] で表される(14)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は(14)記載の通りである。)

(18) 下記一般式 [II-4] で表される(14)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は(14)記載の通りである。)

(19) R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 又は $-SO_2R^{a7}$ (ここで R^{a1} 及び R^{a7} は(14)記載の通り。)である(14)乃至(18)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(20) R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシ基又は $-COOR^{a1}$ (ここで R^{a1} は(14)記載の通り。)である(19)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(21) R^2 がカルボキシ基であり、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子である(20)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(22) 環 Cy' が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である(14)乃至(21)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(23) 環 Cy' が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基である(22)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(24) 環 A' が、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基である(14)乃至(23)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(25) 環 A' が、フェニル基又はピリジル基である(24)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(26) 環 A' が、フェニル基である(25)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(27) Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CH_2R^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-$

$(\text{CH}_2)_m - \text{CR}^{a15}\text{R}^{a16} - (\text{CH}_2)_n$ - 又は $-(\text{CH}_2)_n - \text{NR}^{a12} - \text{CHR}^{a15} -$ (ここで各記号は(14)記載の通り。)である(14)乃至(26)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(28) Yが、 $-(\text{CH}_2)_m - \text{O} - (\text{CH}_2)_n -$ 又は $-\text{O} - (\text{CH}_2)_m - \text{CR}^{a15}\text{R}^{a16} - (\text{CH}_2)_n -$ (ここで各記号は(14)記載の通り。)である(27)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(29) Yが、 $-(\text{CH}_2)_m - \text{O} - (\text{CH}_2)_n -$ (ここで各記号は(14)記載の通り。)である(28)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(30) R^2 がカルボキシル基であり、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、環Cy'がシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、環A'がフェニル基である(14)乃至(29)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(31) 2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例1)、

2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例2)、

1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例3)、

2-[4-(2-プロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例4)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例5)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例6)、

2-[4-(2-プロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例7)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエス

テル（実施例 8）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 9）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [(E) -2-フェニルビニル] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 10）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [(E) -2-フェニルビニル] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 11）、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 12）、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド（実施例 13）、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール（実施例 14）、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミドオキシム（実施例 15）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 16）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 17）、

1-シクロヘキシル-2- (2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 18）、

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 19）、

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 20）、

1-シクロペンチル-2- (4-ニトロフェニル) ベンゾイミダゾール-5-

カルボン酸エチルエステル（実施例 21）、

2-（4-アミノフェニル）-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 22）、

2-（4-ベンゾイルアミノフェニル）-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 23）、

2-（4-ベンゾイルアミノフェニル）-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 24）、

2-〔4-〔3-（3-クロロフェニル）フェノキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 25）、

2-〔4-〔3-（3-クロロフェニル）フェノキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 26）、

2-〔4-（3-アセトキシフェニルオキシ）フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 27）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（3-ヒドロキシフェニルオキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 28）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-（4-ビリジルメトキシ）フェニルオキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 29）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-（4-ビリジルメトキシ）フェニルオキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 30）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール（実施例 31）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル（実施例 32）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-シクロペンチル-N，N-ジメチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド（実施例 33）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-シクロペンチル-N-メトキシ-N-メチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド（実施例 34）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-シクロペンチル-5-（1-ヒド

ロキシー 1-メチルエチル) ベンゾイミダゾール (実施例 35)、

5-アセチル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 36)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-(2-ジメチルアミノエチル) ベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド 二塩酸塩 (実施例 37)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-ニトロベンゾイミダゾール (実施例 38)、

5-アミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例 39)、

5-アセチルアミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 40)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-メタンスルホニルアミノベンゾイミダゾール (実施例 41)、

5-スルファモイル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 42)、

2-[4-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 43)、

2-[4-(4-カルボキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 44)、

2-[4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 45)、

2-{4-[(2-クロロ-5-チエニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 46)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 47)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 48)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-ピリジルメトキシ)フェニル] ベンゾ

イミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 49)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 50)、

1-シクロペンチル-2-{4-[(3, 5-ジメチル-4-イソオキサゾール)メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 51)、

1-シクロペンチル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 52)、

[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-イル]カルボニルアミノ酢酸 (実施例 53)、

2-[4-(2-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 54)、

2-[4-(3-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 55)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 56)、

2-[4-(ベンゼンスルホニルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 57)、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 5-ジクロロフェニルカルボニルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 58)、

2-{4-[(4-クロロフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 59)、

2-{4-[(4-tert-ブチルフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 60)、

2-{4-[(4-ベンジルオキシフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 61)、

trans-4-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]シクロヘキサン-1-オール (実施例 62)、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-メトキシシクロヘキサン (実施例 63)、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - カルボキシメチル - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 64)、

2 - [1 - ベンジルオキシカルボニル - 4 - ピペリジル] - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 65)、

2 - [(4 - シクロヘキシルフェニル) カルボニルアミノ] - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 66)、

1 - シクロペンチル - 2 - [4 - (3, 5 - ジクロロベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 67)、

1 - シクロペンチル - 2 - [4 - (3, 4 - ジクロロベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 68)、

1 - シクロペンチル - 2 - [4 - (フェニルカルバモイルアミノ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 69)、

1 - シクロペンチル - 2 - [4 - (ジフェニルメトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 70)、

1 - シクロペンチル - 2 - (4 - フェネチルオキシフェニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 71)、

trans - 1 - [2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - カルボキシベンゾイミダゾール - 1 - イル] - 4 - tert - ブチルシクロヘキサン (実施例 72)、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - カルボキシメトキシ - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 73)、

2 - (4 - ベンジルアミノフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 74)、

2 - [4 - (N - ベンゼンスルホニル - N - メチルアミノ) フェニル] - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 75)、

2 - [4 - (N - ベンジル - N - メチルアミノ) フェニル] - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 76)、

1 - シクロヘキシル - 2 - (4 - フェネチルフェニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 77)、

2- (1-ベンジル-4-ピペリジル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例78)、

2- (1-ベンゾイル-4-ピペリジル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例79)、

1-シクロペンチル-2- [1- (p-トルエンスルホニル) -4-ピペリジル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例80)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3, 5-ジクロロベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例81)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジフェニルメトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例82)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3, 5-ジ-tert-ブチルベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例83)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1- (4-メチルシクロヘキシル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例84)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (2-ナフチル) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例85)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (1-ナフチル) メトキシフェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例86)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジベンジルアミノ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例87)、

2- [4- (2-ビフェニルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例88)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例89)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジベンジルメトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例90)、

2- (4-ベンゾイルメトキシフェニル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例91)、

2- (4-ベンジル-1-ピペラジニル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダ

ゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩（実施例 92）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,3-ジフェニルプロピルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 93）、

2-[4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 94）、

2-(4-ベンジルオキシピペリジノ)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 95）、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(フェノキシ)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 96）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェニルプロピルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 97）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 98）、

2-(3-ベンジルオキシ-5-イソオキサゾリル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 99）、

2-(2-ベンジルオキシ-5-ピリジル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 100）、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3,4,5-トリメトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 101）、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(4,4-ジメチルシクロヘキシル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 102）、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(1-ナフチル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 103）、

2-[4-(2-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 104）、

2-[4-(3-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 105）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-ヒドロキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 106）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例107)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例108)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例109)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例110)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例111)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例112)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例113)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例114)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例115)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ[b, f]アゼピン-5-イル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例116)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例117)、

2-{4-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例118)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例119)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-メトキシフェニル)エトキシ]

フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 120)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (3-メトキシフェニル) エトキシ]
フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 121)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロヘプチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 122)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 123)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 124)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2, 2-ジフェニルエトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 125)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1- (3-シクロヘキセニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 126)、

cis-1- [2- (4-ベンジルオキシフェニル) -5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル] -4-フルオロシクロヘキサン (実施例 127)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 128)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 129)、

2- {4- [(2R) -2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 130)、

1-シクロヘキシル-2- {2-フルオロ-4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 131)、

2- [4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 132)、

2- {4- [ビス (4-メチルフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 133)、

2- {4- [ビス (4-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 134)、

1-シクロヘキシル-6-メトキシ-2- [4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 135)、

1-シクロヘキシル-6-ヒドロキシ-2- [4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 136)、

1-シクロヘキシル-6-メチル-2- [4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 137)、

2- {4- [2- (2-ベンジルオキシフェニル) エトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 138)、

2- {4- [2- (3-ベンジルオキシフェニル) エトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 139)、

2- [4- (2-カルボキシメチルオキシフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 140)、

2- [4- (3-カルボキシメチルオキシフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 141)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 142)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 143)、

1-シクロヘキシル-2- {2-メチル-4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 144)、

2- {4- [2- (4-tert-ブチルフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 145)、

2- {4- (3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ) -2-フルオロフェ

ニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 4 6)、

2 - { 4 - [3 - クロロ - 6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 4 7)、

2 - { 4 - [ビス (4 - フルオロフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 4 8)、

2 - { 4 - (4 - ベンジルオキシフェノキシ) - 2 - クロロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 4 9)、

2 - { 4 - (4 - ベンジルオキシフェノキシ) - 2 - トリフルオロメチルフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 0)、

2 - { 4 - [3 - クロロ - 6 - (2 - トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 1)、

2 - { 4 - [(2 R) - 2 - アミノ - 2 - フェニルエトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 2)、

2 - [4 - (2 - ビフェニリルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 3)、

2 - [4 - (3 - ビフェニリルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 4)、

2 - { 4 - [2 - { (1 - tert - ブトキシカルボニル - 4 - ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 5)、

2 - { 4 - [3 - { (1 - tert - ブトキシカルボニル - 4 - ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 1 5 6)、

2 - { 4 - [3 - クロロ - 6 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン

酸（実施例 1 5 7）、

2- {4- [2- (2-ビフェニリル) エトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 5 8）、

2- [4- (2-ビフェニリルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 5 9）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (4-ビペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 1 6 0）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-ビペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 1 6 1）、

2- {4- [(2 R) -2-アセチルアミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 2）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-メチル-3-ペンテニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 3）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-メチル-3-ブテニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 4）、

2- {4- [{ (2 S) -1-ベンジル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 1 6 5）、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メチルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 6）、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メタンスルホニルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 7）、

2- {4- [3-クロロ-6- (2-チエニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 8）、

2- {4- [3-クロロ-6- (3-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 1 6 9）、

2- {4- [3-クロロ-6- (3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル}
-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 170)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル}
-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 171)、

2- [4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) -3-フルオロフェニル] -1-
シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 172)、

2- [4- (2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ) フェニル] -1-シク
ロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 173)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-
フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン
酸 (実施例 174)、

2- {4- [2- { (1-アセチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ]
フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例
175)、

2- {4- [3- { (1-アセチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ]
フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例
176)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (2-プロピニルオキシ) フェノキシ]
フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 177)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-ピリジルメトキシ) フェノキシ]
フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 178)、

2- (4-ベンジルオキシ-2-メトキシフェニル) -1-シクロヘキシルベ
ンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 179)、

2- [4- (2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ) フェニル] -1-シ
クロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 180)、

2- [4- (カルボキシジフェニルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシ
ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 181)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ] フェ

ニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 182)、

2 - {4 - [3 - アセチルアミノ - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 183)、

2 - {4 - [2 - (4 - カルボキシフェニル) - 5 - クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 184)、

2 - {4 - [{(2S) - 1 - ベンジルオキシカルボニル - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 185)、

2 - {2 - クロロ - 4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 186)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (2 - ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 187)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - フルオロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 188)、

2 - {4 - [3 - カルボキシ - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 189)、

2 - {4 - [3 - カルバモイル - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 190)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [2 - (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 191)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [2 - (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 192)、

2- {4- [{ (2S) - 1-ベンゼンスルホニル- 2-ピロリジニル} メトキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 193)、

2- {4- [{ (2S) - 1-ベンゾイル- 2-ピロリジニル} メトキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 194)、

2- {4- [2- (4-カルバモイルフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 195)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [3- (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 196)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [3- (ピベリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 197)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [3- { (1-メタンスルホニル- 4-ピベリジル) メトキシ} フェノキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 198)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [{ 2-メチル- 5- (4-クロロフェニル) - 4-オキサゾリル} メトキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 199)、

2- {4- [3- (3-クロロベンジルオキシ) フェノキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 200)、

2- {4- [3- (4-クロロベンジルオキシ) フェノキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 201)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [3- (4-フルオロベンジルオキシ) フェノキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 202)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [{ (2S) - 1- (4-ニトロフェニル) - 2-ピロリジニル} メトキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 (実施例 203)、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [{ (2S) - 1-フェニル- 2-ピロリジ

ニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 204)、

2- {4- [{ (2S) - 1- (4-アセチルアミノフェニル) - 2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 205)、

2- {4- [{5- (4-クロロフェニル) - 2-メチル-4-チアゾリル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 206)、

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 207)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 3-ニトロベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 208)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-テトラヒドロピラニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 209)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 210)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- { (1-メチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 211)、

2- {4- [3- (4-tert-ブチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 212)、

2- {4- [3- (2-クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 213)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-ピリジル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 214)、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} - 1-シク

ロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 1 5）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-（4-メトキシフェニル）フェノキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 1 6）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔〔4-（4-メタンスルホニルフェニル）-2-メチル-5-チアゾリル〕メトキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 1 7）、

2-〔4-〔〔4-（4-クロロフェニル）-2-メチル-5-チアゾリル〕メトキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 1 8）、

2-〔4-〔1-（4-クロロベンジル）-3-ピペリジルオキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 1 9）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-〔（2-メチル-4-チアゾリル）メトキシ〕フェノキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 0）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-〔（2, 4-ジメチル-5-チアゾリル）メトキシ〕フェノキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 1）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔3-（3, 5-ジクロロフェニル）フェノキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 2）、

2-〔4-〔1-（4-クロロベンジル）-4-ピペリジルオキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 3）、

2-〔4-〔3-（4-クロロベンジルオキシ）ピペリジノ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 4）、

2-〔4-〔4-カルバモイル-2-（4-クロロフェニル）ベンジルオキシ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 5）、

2-〔4-〔4-（4-クロロベンジルオキシ）ピペリジノ〕フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 2 2 6）、

2-〔4-〔3-〔（2-クロロ-4-ピリジル）メトキシ〕フェノキシ〕フ

エニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 227)、

2- {4- [{ (2S) - 1- (4-ジメチルカルバモイルフェニル) - 2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 228)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-エトキシカルボニルベンジロキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 229)、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 230)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-ジメチルカルバモイルフェニル) - 2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 231)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-ジメチルカルバモイルベンジロキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 232)、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) - 2-メチル-5-ピリミジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 233)、

2- {4- [{2- (4-クロロフェニル) - 3-ピリジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 234)、

2- {4- [{3- (4-クロロフェニル) - 2-ピリジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 235)、

2- {4- [2- (3-クロロフェニル) - 4-メチルアミノ-1, 3, 5-トリアジン-6-イルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩 (実施例 236)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 4- (5-テトラゾリル) ベンジ

ルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 237)、

2- [4- (4-ベンジルオキシ-6-ピリミジニルオキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 238)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [4- (4-ピリジリメトキシ) - 6-ピリミジニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 239)、

2- {4- [4- (3-クロロフェニル) - 6-ピリミジニルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 240)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 241)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 242)、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (実施例 243)、

2- [4- (2-ブromo-5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 244)、

2- {4- [5-tert-ブトキシカルボニル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 245)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩 (実施例 246)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸

メチルエステル（実施例 247）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジル
オキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸
塩酸塩（実施例 248）、

2- {4- [3- (tert-ブチルスルファモイル) -6- (4-クロロフ
ェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール
-5-カルボン酸（実施例 249）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-スルファモイルベンジルオキ
シ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ト
リフルオロ酢酸塩（実施例 250）、

2- (4-ベンジルオキシシクロヘキシル) -1-シクロヘキシルベンゾイミ
ダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 251）、

2- [2- (2-ピフェニルオキシメチル) -5-チエニル] -1-シクロ
ヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 252）、

2- [2- (2-ピフェニルオキシメチル) -5-フリル] -1-シクロヘ
キシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 253）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-ヒ
ドロキシメチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-
5-カルボン酸（実施例 254）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-カルボキシフェニル) -2-
メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カル
ボン酸 塩酸塩（実施例 255）、

1-シクロヘキシル-2- {2-フルオロ-4- [4-フルオロ-2- (3-
フルオロベンゾイル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カ
ルボン酸（実施例 256）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フ
ェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸（実施例 2
57）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フ

エニル} - 3 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 4 - カルボン酸 (実施例 258)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - ジメチルカルバモイル - 5 - (4 - ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 259)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - カルボキシ - 5 - (4 - ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 260)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 4 - カルボン酸 (実施例 261)、

2 - {4 - [3 - カルバモイル - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 262)、

2 - {4 - [{2 - (4 - カルボキシフェニル) - 3 - ピリジル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 263)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1 - (4 - テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 264)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ジメチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 265)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - ジメチルカルバモイル - 6 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 266)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - ジメチルカルバモイル - 6 - (4 - メチルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 267)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルカルバモイルベンジル
オキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-
5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 268)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-ジメチルカルバモイルベンジ
ルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール
- 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 269)、

2- {4- [3-カルバモイル-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]
- 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カル
ボン酸 塩酸塩 (実施例 270)、

2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-6- (4-メタンスルホニルフェニ
ル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5
-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 271)、

2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-6- (3-ピリジル) ベンジルオキ
シ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二
塩酸塩 (実施例 272)、

2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-6- (4-ジメチルカルバモイルフ
ェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール
- 5-カルボン酸 (実施例 273)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フ
ェニル} - 1- (1-オキソ-4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾ
ール-5-カルボン酸 (実施例 274)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フ
ェニル} - 1- (1, 1-ジオキソ-4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイ
ミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 275)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] -
2-フルオロフェニル} - 1- (4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダ
ゾール-5-カルボン酸 (実施例 276)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] -
2-フルオロフェニル} - 1- (1-オキソ-4-テトラヒドロチオピラニル)

ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 277）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- (1, 1-ジオキソ-4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 278）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジメチルスルファモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 279）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メタンスルホニルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 280）、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩（実施例 281）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジメチルアミノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩（実施例 282）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メタンスルホニルアミノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 283）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジエチルカルバモイルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 284）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-イソプロピルカルバモイルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 285）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ピペリジノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例 286）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (1-ピロリジニル) カルボ

ニルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 287)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-ヒドロキシエチル) カルバモイルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 288)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジノ) カルボニルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 289)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- モルホリノカルボニルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 290)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- チオモルホリノカルボニルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 291)、

2- {4- [3- (カルボキシメチルカルバモイル) - 6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 292)、

2- {4- [2- {4- (2-カルボキシエチル) フェニル} - 5-クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 293)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-ヒドロキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 294)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メトキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 295)、

2- {4- [2- (3-カルボキシフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 296)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルチオベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 297)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルスルフィニルベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 298)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-シアノベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 299)、

2- {4- [ビス (3-ピリジル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 300)、

2- {4- [ビス (4-ジメチルカルバモイルフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 301)、

2- {4- [2-チエニル-3-チエニルメトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩 (実施例 302)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 303)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩 (実施例 304)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 305)、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 306)、

2- {4- [2- (4-カルバモイルフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例307)、

2- {4- [5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例308)、

2- {4- [5- (4-クロロフェニル) -2-メトキシベンジルスルフィニル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例309)、

2- {4- [5- (4-クロロフェニル) -2-メトキシベンジルスルホニル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例310)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルチオ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例311)、

2- {4- [ビス (4-カルボキシフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例312)、

2- [4- (フェニル-3-ピリジルメトキシ) -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例313)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例314)、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-ピリジル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例315)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ベンジルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例316)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (シクロヘキシルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 317)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-ピリジルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 318)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-ベンジル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 319)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 501)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸 (実施例 502)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロペンチル-1H-インドール-5-カルボン酸 (実施例 503)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル (実施例 601)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸 (実施例 602)、及び

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 (実施例 701) からなる群より選ばれる一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(32) (14) 乃至 (31) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る医薬組成物。

(33) (1) 乃至 (31) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る C 型肝炎ウイルスポリメラ

一ゼ阻害剤。

(34) (1) 乃至 (31) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る抗C型肝炎ウイルス剤。

(35) (14) 乃至 (31) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成るC型肝炎治療剤。

(36) 有効量の上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎の治療方法。

(37) 有効量の上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害方法。

(38) C型肝炎治療用医薬を製造するための上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

(39) C型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤を製造するための上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

(40) 上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含むC型肝炎治療用医薬組成物。

(41) 上記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含むC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害用医薬組成物。

(42) (40) 記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎の治療用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

(43) (41) 記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

本明細書において使用する各置換基及び各部位の定義は、次の通りである。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子又は臭素原子である。

特に好ましくは、 R^6 、 $R^{6'}$ 、 R^6 、 $R^{6'}$ 、グループA及びグループCにおいてフッ素原子であり、X、Z、Z'、グループB及びグループDにおいてフッ素原

子又は塩素原子である。

「C1-6アルキル基」とは、炭素数1乃至6の直鎖又は分岐鎖アルキル基を表し、具体的にはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、tert-ペンチル基、ヘキシル基等が挙げられる。

好ましくは炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、特に好ましくは、 R^{a7} 、 R^{a8} 、 R^{a9} 、 R^{a16} 、 R^{a16} 、 R^{a17} 、 R^{a29} 、 R^{a33} 、 R^{b6} 及び R^{b7} においてメチル基であり、 R^{b1} 、 R^{b2} 、グループB及びグループCにおいてメチル基又はtert-ブチル基である。

「ハロゲン化C1-6アルキル基」とは、上記定義の「C1-6アルキル基」が上記定義の「ハロゲン原子」で置換されたものであり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるハロゲン化アルキル基である。具体的には、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、プロモメチル基、クロロメチル基、1,2-ジクロロメチル基、2,2-ジクロロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基等が挙げられる。

グループBにおいて特に好ましくは、トリフルオロメチル基である。

「C1-6アルキレン」とは、炭素数1乃至6の直鎖アルキレンを表し、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレンが挙げられる。

Yにおいて好ましくは、メチレン又はエチレンである。

「C2-6アルケニレン」とは、炭素数2乃至6の直鎖アルケニレンを表し、ビニレン、プロベニレン、1-ブテニレン、1,3-ブタジエニレン等が挙げられる。

Yにおいて好ましくは、ビニレンである。

「C1-6アルコキシ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であるアルキル-オキシ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルコキシ基である。具体的にはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、tert-ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられる。

R^{a2}、R^{a3}、グループA及びグループCにおいて特に好ましくは、メトキシ基である。

「C1-6アルカノイル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であるアルキル-カルボニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルカノイル基である。具体的にはアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、ヒバロイル基等が挙げられる。

R¹、R²、R³、R⁴、R^{a5}、R^{a29}、R^{b7}、グループBにおいて特に好ましくは、アセチル基である。

「C1-6アルコキシカルボニル基」とは、そのアルコキシ部位が上記定義の「C1-6アルコキシ基」であるアルキル-オキシ-カルボニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルコキシカルボニル基である。具体的には、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブチルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{a10}及びグループAにおいて特に好ましくは、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基である。

「C1-6アルキルアミノ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であるアルキル-アミノ基若しくはジアルキル-アミノ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルアミノ基若しくはジアルキルアミノ基である。具体的にはメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、N-イソプロピル-N-イソブチルアミノ基等が挙げられる。

R^{a7}において特に好ましくはメチルアミノ基であり、R^{a21}及びグループAにおいて特に好ましくはジメチルアミノ基である。

「C1-6アルカノイルアミノ基」とは、そのアルカノイル部位が上記定義の「C1-6アルカノイル基」であるアルキル-カルボニル-アミノ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルカルボニルアミノ基である。具体的にはアセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、ピバロイルアミノ基等が挙げられる。

X及びR⁴¹⁰において特に好ましくは、アセチルアミノ基である。

「C1-6アルキルスルホニル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であるアルキル-スルホニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルスルホニル基である。具体的には、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基等が挙げられる。

X及びR⁴⁵において特に好ましくは、メチルスルホニル基である。

「C6-14アリール基」とは、炭素数6乃至14の芳香族炭化水素基であり、具体的にはフェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基等が挙げられる。

環A、環A'、環B及び環B'において、好ましくはフェニル基又はナフチル基、特に好ましくはフェニル基である。

「C3-8シクロアルキル基」とは、炭素数3乃至8個、好ましくは5乃至7個の飽和シクロアルキル基であり、具体的にはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基及びシクロオクチル基である。

環A、環A'、環B及び環B'において特に好ましくは、シクロヘキシル基である。

「C3-8シクロアルケニル基」とは、炭素数3乃至8個、好ましくは5乃至7個のシクロアルケニル基であり、少なくとも1個、好ましくは1又は2個の二重結合を含む。具体的にはシクロプロベニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニ

ル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基、2, 4-シクロヘキサジエン-1-イル基、2, 5-シクロヘキサジエン-1-イル基、シクロヘプテニル基及びシクロオクテニル基等が挙げられ、フェニル基の様なアリール基及び完全飽和のシクロアルキル基を含まない。

環A、環A' において好ましくは、シクロヘキセニル基である。

「ヘテロ環基」とは、環を構成する原子として、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有し、環を構成する原子の数が3乃至14であり、飽和環及び不飽和環、単環及び縮合環を含む。

単環であるヘテロ環基として具体的には、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピベリジル基、ピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基等が挙げられる。

また、縮合環であるヘテロ環基として具体的には、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シンノリニル基、ナフチリジニル基、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基等が挙げられる。

好ましくは、5員環或いは6員環の単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピベリジル基、ピベラジニル基等が挙げられる。

環A及び環A' において特に好ましくは、芳香族であるビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基であり、さらに好ましくはビリジル基である。

環B及び環B'において特に好ましくは、芳香族であるピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基である。更に好ましくはピリジル基、チアゾリル基であり、最も好ましくはチアゾリル基である。

「C6-14アリールC1-6アルキル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であり、アリール部位が上記定義の「C6-14アリール基」であるアリール-アルキル基である。好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基であり、アリール部位がフェニル基であるアリール-アルキル基であり、具体的には、ベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基等が挙げられる。

R^{a8}及びR^{b6}において特に好ましくは、ベンジル基である。

「C6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基」とは、そのC6-14アリールC1-6アルキル部位が上記定義の「C6-14アリールC1-6アルキル基」である、アリール-アルキル-オキシカルボニル基である。好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基であり、アリール部位がフェニル基であるアリール-アルキル-オキシカルボニル基であり、具体的には、ベンジルオキシカルボニル基、フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロピルオキシカルボニル基、2-フェニルプロピルオキシカルボニル基、4-フェニルブチルオキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{b7}において特に好ましくは、ベンジルオキシカルボニル基である。

「置換されてもよいC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C1-6アルキル基」、好ましくは炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルキル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、上記定義の「C1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6アルキルアミノ基」から選ばれる。「置換されてもよいC1-6アルキル基」として具体的には、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、

ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、tert-ペンチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、4-ヒドロキシブチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル、カルボキシルメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシメチル基、エトキシカルボニルメチル基、2-エトキシカルボニルエチル基、2-ジメチルアミノエチル基等が挙げられる。

好ましくは、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 においてメチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル、カルボキシルメチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ においてはメチル基又はトリフルオロメチル基であり、 R^7 、 R^8 、 R^{a18} 、 R^{a24} 、 R^{a25} 、 R^{a31} 及び R^{b5} においてはメチル基であり、 R^{a1} 及び R^{a19} においてはメチル基、エチル基、 R^{a2} 及び R^{a3} においてはメチル基、カルボキシルメチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 R^{a6} においてはメチル基又はカルボキシルメチル基であり、Xにおいてはメチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基又はトリフルオロメチル基であり、 R^{a10} においては、メチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基又はカルボキシルメチル基であり、 R^{a11} においてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、トリフルオロメチル基、2-ヒドロキシエチル基又はカルボキシルメチル基であり、 R^{a12} においてはメチル基又は4-ヒドロキシブチル基であり、 R^{a13} においてはメチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ヒドロキシエチル基、4-ヒドロキシブチル基、エトキシカルボニルメチル基、2-(エトキシカルボニル)エチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 R^{a20} においてはメチル基、プロピル基、ブチル基、イソペンチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、又はカルボキシメチル基であり、 R^{a22} 及び R^{a23} においてはメチル基、エチル基であり、 R^{a26} においてはメチル基又はtert-ブチル基であり、 R^{a27} 及び R^{a28} においてはメチル基、エチル基、イソプロピル基、2-ヒドロキシエチル基又はカルボキシルメチル基であり、Z、Z' 及びグループDにおいてはメチル

基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシメチル基又はエトキシカルボニルメチル基である。

特に好ましくは、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 及び $R^{6'}$ においてはトリフルオロメチル基であり、 R^{a26} においてはメチル基又はtert-ブチル基であり、Z、Z'及びグループDにおいてはメチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基又はヒドロキシメチル基であり、その他各置換基においてはメチル基である。

「置換されてもよいC2-6アルケニル基」とは、炭素数2乃至6の直鎖又は分岐鎖アルケニル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルケニル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、上記定義の「C1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6アルキルアミノ基」から選ばれる。「置換されてもよいC2-6アルケニル」として具体的には、ビニル基、アリル基、1-プロベニル基、イソプロベニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、2-イソペンテニル基、3-イソヘキセニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、2-カルボキシエテニル基等が挙げられる。

Xにおいて好ましくは2-カルボキシエテニル基であり、 R^{a20} において好ましくは、2-イソペンテニル基、3-イソヘキセニル基又は4-メチル-3-ペンテニル基である。

「置換されてもよいC2-6アルキニル基」とは、炭素数2乃至6の直鎖又は分岐鎖アルキニル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルキニル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、上記定義の「C1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6アルキルアミノ基」から選ばれる。具体的にはエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^{a20} において好ましくは、2-プロピニル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」とは、上記定義の「C6-14アリール基」が1乃至5個の置換基で置換さ

れてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記定義の「ハロゲン原子」、シアノ基、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ （ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又は上記定義の「C1-6アルキル基」であり、 r は0又は1乃至6の整数である。）から選ばれる。

具体的にはフェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-アセチルフェニル基、4-カルボキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-アミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-(メチルスルホニルアミノ)フェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基、4-ニトロ-3-メトキシフェニル基が挙げられる。

アリール部位において好ましくはフェニル基であり、グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基又はメトキシ基である。特に好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」として好ましくは、 R^{a12} 、 R^{a27} 及び R^{a28} においてはフェニル基、

4-tert-ブチルフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-メトキシフェニル基又は4-トリフルオロメチルフェニル基であり、R^{a14}、R^{a22}、R^{a23}、R^{a26}及びR^{b5}においてフェニル基、R^{a18}においてはフェニル基、3-フルオロフェニル基、R^{a20}においてはフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、R^{a24}においてはフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基又は4-ニトロ-3-メトキシフェニル基、R^{a25}においてはフェニル基又は4-メチルフェニル基である。

各置換基において特に好ましくは、フェニル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」とは、上記定義の「C6-14アリール基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(p)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(カルボキシメチル)アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、イソペンチルオキシ基、2-イソペンテニルオキシ基、3-イソヘキセニルオキシ基、4-メチル-3-ペンテニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基が挙げら

れる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアル基」として具体的には、フェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシエチル)フェニル基、3-カルボキシフェニル基、4-カルボキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-シアノフェニル基、4-アセチルフェニル基、4-アミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-(メチルスルホニルアミノ)フェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基又は4-ニトロ-3-メトキシフェニル基が挙げられる。

Z及びZ'において、アリアル部位として好ましくはフェニル基であり、グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CO-NR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアル基」として具体的に好ましくは、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェ

ニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシルエチル)フェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基である。

特に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 又は $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基、アセチルアミノ基である。更に好ましくはフッ素原子、塩素原子、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基であり、最も好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基は、上記定義の「ハロゲン原子」、シアノ基、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ (ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又は上記定義の「C1-6アルキル基」であり、 r は0又は1乃至6の整数である。)から選ばれる。

具体的には、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロピリジン-4-イル基、3-クロロピリジン-4-イル基、4-クロロピリジ

ン-3-イル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、2-メチルオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル基、2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、3-ヒドロキシピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピベリジル基、3-ヒドロキシピベリジノ基、4-ヒドロキシピベリジノ基、3, 4-ジヒドロキシピベリジノ基、4-メトキシピベリジノ基、4-カルボキシピベリジノ基、4-(ヒドロキシメチル)ピベリジノ基、2-オキソピベリジノ基、4-オキソピベリジノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチルピベリジノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ヒドロキシピベリジノ基、N-メチルピベリジン-4-イル基、N-(tert-ブトキシカルボニル)ピベリジン-4-イル基、N-アセチルピベリジン-4-イル基、N-メチルスルホニルピベリジン-4-イル基、ピベラジニル基、4-メチルスルホニルピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、1-オキソチオモルホリン-4-イル基、1, 1-ジオキソチオモルホリン-4-イル基、テトラヒドロピラニル基、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シンノリニル基、ナフチリジニル基、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基等が挙げられる。

ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或いは6員環の単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピベリジル基、ピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、グループBとして好ま

しくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として、好ましくはピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、1-ピペラジニル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル基、1-ピロリジニル基、モルホリノ基、4-チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、ビリジル基、チアゾリル基である。特に好ましくは、 R^{a18} においてピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、1-ピペラジニル基、1-ピロリジニル基、モルホリノ基、4-チオモルホリニル基であり、 R^{a20} においてはテトラヒドロピラニル基又は4-ヒドロキシピペリジノ基であり、 R^{a21} においてはピペリジノ基であり、 R^{a24} 及び R^{a25} においてはビリジル基であり、 R^{a26} においてはビリジル基又はチアゾリル基であり、 R^{a27} 又は R^{a28} においては1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル基、3-ヒドロキシピロリジニル基、3-ヒドロキシピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、3,4-ジヒドロキシピペリジノ基、4-メトキシピペリジノ基、4-カルボキシピペリジノ基、4-(ヒドロキシメチル)ピペリジノ基、2-オキソピペリジノ基、4-オキソピペリジノ基、2,2,6,6-テトラメチルピペリジノ基、2,2,6,6-テトラメチル-4-ヒドロキシピペリジノ基、4-メチルスルホニルピペラジニル基、1-オキソチオモルホリン-4-イル基又は1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基は、上記グループD((a)乃至(p)に示される置換基)から選ばれる。

グループDとして具体的には、「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」で挙げられた置換基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として具体的には、2-ビリジル基、3-ビリジル基、4-ビリジル基、3-フルオロピリジン-4-イル基、3-クロロピリジン-4-イル基、4-クロロピ

リジン-3-イル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、2-メチルオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル基、2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピペリジル基、N-メチルピペリジン-4-イル基、N-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イル基、N-アセチルピペリジン-4-イル基、N-メチルスルホニルピペリジン-4-イル基、ピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シノリニル基、ナフチリジニル基、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基等が挙げられる。

また、2-ピリジル基の3, 4, 5又は6位、3-ピリジル基の2, 4, 5又は6位、4-ピリジル基の2, 3, 5又は6位、2-チエニル基の3, 4又は5位、3-チエニル基の2, 4又は5位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

Z及びZ'において、ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或いは6員環、単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、

グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

具体的な「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として好ましくは、ピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、1-ピペラジニル基、1-ピロリジニル基、モルホリノ基、4-チオモルホリニル基、4-テトラヒドロピラニル基、3-ピリジル基、2-ピリミジニル基、5-テトラゾリル基、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-チエニル基である。

特に好ましくは、ピリジル基、ピリミジニル基、テトラゾリル基、チエニル基又はピペリジル基である。

「グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が、水酸基、上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルコキシ基」から選ばれる置換基により1乃至5置換されてもよいものであり、無置換であってもよい。具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、特に好ましくはシクロヘキシル基である。

環Cy及び環Cy'において好ましくは、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、4-フルオロシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基であり、特に好ましくは

シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、更に好ましくはシクロヘキシル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

また、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」として、R^{a27}及びR^{a28}において特に好ましくはシクロヘキシル基又は4-ヒドロキシシクロヘキシル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキル基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(p)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」で挙げられた置換基が挙げられる。

具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロ

ヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

また、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、Z及びZ'において特に好ましくはシクロヘキシル基である。

「置換されてもよいC3-8シクロアルケニル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルケニル基」が、水酸基、上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルコキシ基」から選ばれる置換基により置換されてもよいものであり、無置換であってもよい。具体的には、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基、4-フルオロ-2-シクロヘキセニル基、4-メチル-2-シクロヘキセニル基、4-メチル-3-シクロヘキセニル基、2,4-シクロヘキサジエン-1-イル基、2,5-シクロヘキサジエン-1-イル基、シクロヘプテニル基及びシクロオクテニル基等が挙げられ、フェニル基の様なアリール基及び完全飽和のシクロアルキル基を含まない。

環Cyにおいて、特に好ましくはシクロヘキセニル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C6-14アリールC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリールアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的にはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、フェ

ネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、ペンタフルオロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-シアノベンジル基、4-アセチルベンジル基、4-カルボキシルベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、4-アミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、4-(メチルスルホニルアミノ)ベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4,5-トリメトキシベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基、3-ニトロ-4-メトキシベンジル基、4-ニトロ-3-メトキシベンジル基が挙げられる。

C6-14アリールC1-6アルキル部位において好ましくはベンジル基、フェネチル基であり、特に好ましくはベンジル基である。グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基又はトリフルオロメチルオキシ基である。特に好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」として、 R^{a12} 及び R^{a13} において好ましくはベンジル基、フェネチル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基又は3-トリフルオロメチルベンジル基、 R^{a1} 、 R^{a19} 、 R^{a27} 、 R^{a28} 、 R^{a31} 、 R^{b5} において好ましくはベンジル基であり、 R^{a20} において好ましくはベンジル基、フェネチル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基であり、 R^{a22} 及び R^{a23} において4-クロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基である。

各置換基において特に好ましくは、ベンジル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C6-14アリールC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(p)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(カルボキシメチル)アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」として具体的にはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、4-プロモベンジル基、4-ニトロベンジル基、ペンタフルオロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-(ヒドロキシメチル)ベンジル基、4-(メトキシメチル)ベンジル基、4-(2-カルボキシエチル)ベンジル基、3-カルボキシベンジル基、4-カルボキシ

ルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4, 5-トリメトキシベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)ベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-(アセチルアミノ)ベンジル基、4-シアノベンジル基、4-アセチルベンジル基、4-アミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、4-(メチルスルホニルアミノ)ベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基、(3-ニトロ-4-メトキシフェニル)メチル基又は(4-ニトロ-3-メトキシフェニル)メチル基が挙げられる。

Z及びZ'において、C6-14アリールC1-6アルキル部位として好ましくはベンジル基又はフェネチル基であり、グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」として具体的に好ましくは、ベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、4-プロモベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-(ヒドロキシメチル)ベンジル基、4-(メトキシメチル)ベンジル基、4-(2-カルボキシルエチル)ベンジル基、3-カルボキシルベンジル基、4-カルボキシルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4, 5-トリメトキシベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)ベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基である。

特に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、-

$(\text{CH}_2)_t - \text{OR}^{\text{a20}}$ 又は $-(\text{CH}_2)_t - \text{S}(\text{O})_q - \text{R}^{\text{a25}}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基、アセチルアミノ基である。更に好ましくはフッ素原子、塩素原子、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシ基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基又はメチルスルホニル基であり、最も好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」とは、上記定義の「ヘテロ環C1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環C1-6アルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピロリルメチル基、イミダゾリルメチル基、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フリルメチル基、2-オキサゾリルメチル基、5-イソチアゾリルメチル基、2-メチルオキサゾール-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾール-4-イルメチル基、2-メチルチアゾール-5-イルメチル基、2,5-ジメチルチアゾール-4-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基、2,4-ジメチルチアゾール-5-イルメチル基、2-イソチアゾリルメチル基、2-ピロリニルメチル基、ピロリジニルメチル基、ピベリジルメチル基、4-ピベリジルメチル基、1-メチルピベリジン-4-イルメチル基、2-(4-ヒドロキシピベリジノ)エチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピベリジン-4-イルメチル基、1-アセチルピベリジン-4-イルメチル基、1-メチルスルホニルピベリジン-4-イルメチル基、ピベラジニルメチル基、モルホリノメチル基、チオモルホリニルメチル基、1-テトラヒドロピラニルメチル基、2-キノリルメチル基、1-イソキノリルメチル基等が挙げられる。

ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或いは6員環、単環であるヘテロ環基

であり、具体的には、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピベリジル基、ピベラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、アルキル部位として好ましくは炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基である。また、グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 又は $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」として好ましくは、2-ビリジルメチル基、3-ビリジルメチル基、2-クロロビリジン-4-イルメチル基、4-ビリジルメチル基、ピベリジン-4-イルメチル基、1-メチルピベリジン-4-イルメチル基、2-(4-ヒドロキシピベリジノ)エチル基、1-アセチルピベリジン-4-イルメチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピベリジン-4-イルメチル基、1-(メチルスルホニル)ピベリジン-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾリン-4-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基である。特に好ましくは、 R^{a20} において2-ビリジルメチル基、3-ビリジルメチル基、2-クロロビリジン-4-イルメチル基、4-ビリジルメチル基、ピベリジン-4-イルメチル基、1-メチルピベリジン-4-イルメチル基、2-(4-ヒドロキシピベリジノ)エチル基、1-アセチルピベリジン-4-イルメチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピベリジン-4-イルメチル基、1-(メチルスルホニル)ピベリジン-4-イルメチル基、2-メチルチアゾリン-4-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基であり、 R^{a22} 及び R^{a23} においては2-ビリジルメチル基、 R^{a27} 及び R^{a28} においては4-ビリジルメチル基及び4-メチルチアゾール-2-イルメチル基である。

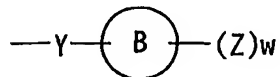
「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキルアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-(シクロペンチル)エチル基、2-(シクロヘキシル)エチル基、シクロヘプチルメチル基、4-フルオロシクロヘキシルメチル基、2-メチルシクロペンチルメチル基、3-メチルシクロヘキシルメチル基、4-メチルシクロヘキシルメチル基、4,4-ジメチルシクロヘキシルメチル基、3,5-ジメチルシクロヘキシルメチル基、4-tert-ブチルシクロヘキシルメチル基、4-ヒドロキシシクロヘキシルメチル基、4-メトキシシクロヘキシルメチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシルメチル基が挙げられる。

また、シクロペンチルメチル基又はシクロヘキシルメチル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチルメチル基又はシクロヘキシルメチル基であり、 R^{a20} 、 R^{a27} 及び R^{a28} において特に好ましくはシクロヘキシルメチル基である。

一般式[I]において、Xとして好ましくは、



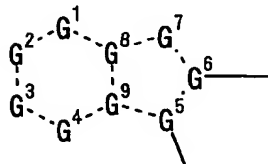
(式中、各記号の定義は前記の通り。)である。

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 として好ましくは、それぞれ(C-R¹)、(C-R²)、(C-R³)及び(C-R⁴)であり、 G^5 として好ましくは窒素原子であり、 G^6 、 G^8 及び G^9 として好ましくは炭素原子である。 G^7 として好ましくは、C(-R⁷)

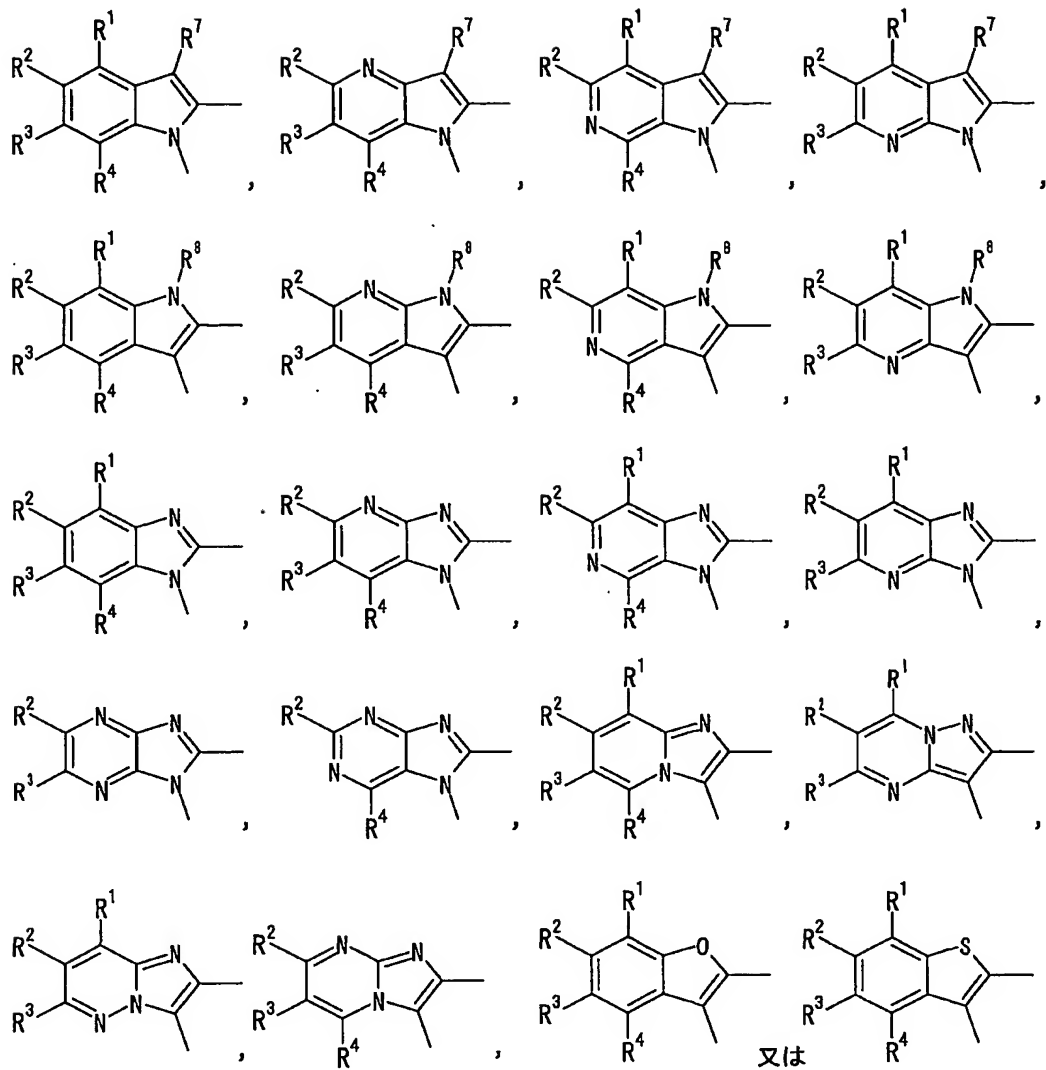
又は無置換の窒素原子であり、この時 R^7 として好ましくは水素原子である。

組合せとして好ましくは、 G^2 が $(C-R^2)$ 、かつ G^6 が炭素原子であり、特に好ましくは、 G^2 が $(C-R^2)$ 、 G^6 が炭素原子、かつ G^5 が窒素原子であり、最も好ましくは、 G^2 が $(C-R^2)$ 、 G^6 が炭素原子、 G^5 が窒素原子、かつ G^7 が無置換の窒素原子である。

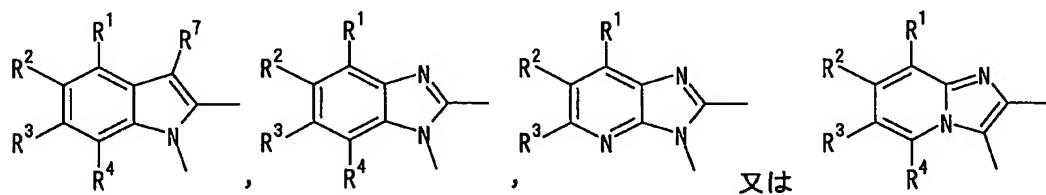
一般式 [I] 及び [II] の



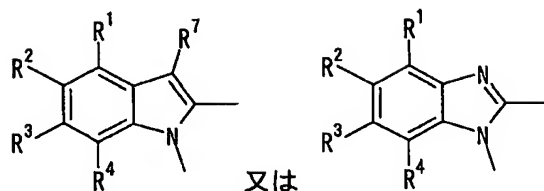
部位において好ましくは、 G^1 乃至 G^9 のうち 1 乃至 4 個が窒素原子であるものであり、具体的に好ましくは、



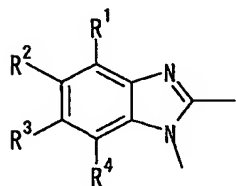
であり、特に好ましくは、



であり、更に好ましくは、



であり、最も好ましくは、



である。

R^1 及び R^4 において好ましくは水素原子である。 R^2 において好ましくはカルボキシル基、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{CONR}^{a2}\text{R}^{a3}$ 又は $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$ （各記号は前記定義の通り。）であり、特に好ましくはカルボキシル基、 $-\text{COOR}^{a1}$ 又は $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$ であり、更に好ましくはカルボキシル基又は $-\text{COOR}^{a1}$ であり、最も好ましくはカルボキシル基である。 R^3 において好ましくは水素原子又は $-\text{OR}^{a6}$ （ R^{a6} は前記定義の通り。）であり、特に好ましくは水素原子である。

環Cy及び環Cy'において好ましくは、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基であり、特に好ましくはシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、更に好ましくはシクロヘキシル基である。

環A及び環A'において好ましくはフェニル基、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基又はチエニル基であり、特に好ましくはフェニル基、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基であり、更に好ましくはフェニル基又はビリジル基であり、最も好ましくはフェニル基である。

環B及び環B'において好ましくは「C1-6アリール基」又は「ヘテロ環基」であり、具体的に好ましくは、フェニル基、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル

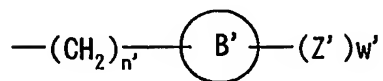
ル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基又はチアジアゾリル基であり、特に好ましくはフェニル基、ピリジル基、ピリミジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基又はチアゾリル基であり、更に好ましくは、フェニル基、ピリジル基又はチアゾリル基であり、最も好ましくはフェニル基又はチアゾリル基である。

R^5 及び R^6 においては、何れか一方が水素原子かつ他方がハロゲン原子、特にフッ素原子であるか、両者が水素原子であるときが好ましい。環Aがフェニル基のとき、 R^5 及び R^6 は G^5 -からオルト位に位置することが好ましい。また $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ においても同様である。

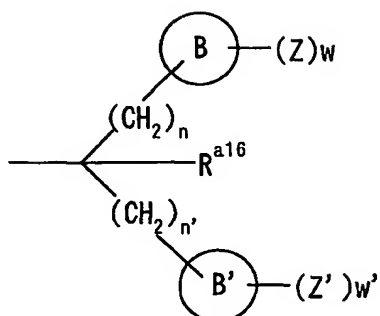
Yにおいて好ましくは、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CHR^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 又は $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$ （各記号の定義は前述の通り。）であり、更に好ましくは、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 又は $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ であり、最も好ましくは $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ である。

Yにおける1、m及びnにおいて好ましくは0又は1乃至4の整数であり、特に好ましくは0、1又は2である。 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ において更に好ましくは $m=n=0$ 若しくは $m=0$ かつ $n=1$ であり、最も好ましくは $m=n=0$ である。また $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ において更に好ましくは $m=n=0$ 、 $m=0$ かつ $n=1$ 、 $m=1$ かつ $n=0$ 若しくは $m=1$ かつ $n=1$ であり、最も好ましくは $m=n=0$ である。

Yが $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ の時、 R^{a16} として好ましくは水素原子であり、 R^{a15} として好ましくは、



であり、この時、



部位は対称形であることが好ましく、 n 、環 B 、 Z 、 w における好ましい態様と、 n' 、環 B' 、 Z' 、 w' における好ましい態様はそれぞれ同一である。

環 A がフェニル基のとき、 X 若しくは Y は G^6 に対してパラ位に位置することが好ましい。環 B 及び環 B' がフェニル基のとき Z は Y に対してオルト位若しくはメタ位に置換することが好ましく、フェニル基上の3位に1つの置換基が置換すること若しくはフェニル基上の2位及び5位に1つずつの置換基が置換することが好ましい。

また環 B がチアゾリル基のとき Y は5位に置換することが好ましく、この時 Z は2位、4位若しくは2位及び4位に置換されることが好ましい。同様に環 B' がチアゾリル基のとき $(CH_2)_n$ もまた5位に置換することが好ましく、この時 Z' は2位、4位若しくは2位及び4位に置換されることが好ましい。

Z 及び Z' として好ましくはグループ D 、「グループ D から選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」又は「グループ D から選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」であり、特に好ましくはグループ D 又は「グループ D から選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」である。

更に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ 、或いはそれらで置換されてもよいC6-14アリール基又はヘテロ環基である。

Z 及び Z' において、それぞれ環 B 及び環 B' に直接置換するグループ D の好ましい態様と、C6-14アリール基、C3-8シクロアルキル基、C6-14アリールC1-6

アルキル基又はヘテロ環基上に置換するグループDの好ましい態様とは、同様なものが挙げられ、それぞれ同一若しくは異なってもよい。

具体的な置換基として好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*tert*-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(カルボキシルメチル)アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、2-イソペンテニルオキシ基、3-イソヘキセニルオキシ基、4-メチル-3-ペンテニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、トリフルオロメチルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシルメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、*tert*-ブチルアミノスルホニル基、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-メチルフェニル基、4-エチルフェニル基、4-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-*tert*-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェニル基、4-(2-ヒドロキシエチル)フェニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシルエチル)フェニル基、4-(メトキシカルボニルメチル)フェニル基、4-(エトキシカルボニルメチル)フェニル基、4-アセチルフェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、

4- (メトキシカルボニル)、フェニル基、4- (エトキシカルボニル) フェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4- (メチルアミノカルボニル) フェニル基、4- (イソプロピルアミノカルボニル) フェニル基、4- (ジメチルアミノカルボニル) フェニル基、4- (ジエチルアミノカルボニル) フェニル基、4- [(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル] フェニル基、4- [(カルボキシルメチル) アミノカルボニル] フェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、4-プロピルオキシフェニル基、4-イソプロピルオキシフェニル基、4-ブチルオキシフェニル基、4-イソペンチルオキシフェニル基、4- (2-イソペンテニルオキシ) フェニル基、4- (3-イソヘキセニルオキシ) フェニル基、4- (4-メチル-3-ペンテニルオキシ) フェニル基、4- (2-プロピニルオキシ) フェニル基、4- (トリフルオロメチルオキシ) フェニル基、4- (ヒドロキシメチルオキシ) フェニル基、4- (カルボキシルメチルオキシ) フェニル基、4- [(ジメチルアミノカルボニル) メチルオキシ] フェニル基、4-アミノフェニル基、4- (メチルアミノ) フェニル基、4- (ジメチルアミノフェニル) 基、4- (ジエチルアミノ) フェニル基、4- (アセチルアミノ) フェニル基、4- (メチルスルホニルアミノ) フェニル基、4- (メチルチオ) フェニル基、4- (メチルスルホニル) フェニル基、4- (メチルスルフィニル) フェニル基、4- (アミノスルホニル) フェニル基、4- (メチルアミノスルホニル) フェニル基、4- (ジメチルアミノスルホニル) フェニル基、4- (tert-ブチルアミノスルホニル) フェニル基、シクロヘキシル基、ベンジル基、4-クロロベンジル基、フェネチル基、ベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、4-tert-ブチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、2-チエニル基、2-チアゾリル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-ピリミジニル基、5-テトラゾリル基、ピペリジノ基、ピペリジノカルボニル基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、1-ピペラジニルカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、モルホリノカルボニル基、4-チオモルホリニルカルボニル基、フ

エノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、テトラヒドロピラニルオキシ基、2-ピリジルメチルオキシ基、3-ピリジルメチルオキシ基、2-クロロピリジン-4-イルメチルオキシ基、4-ピリジルメチルオキシ基、2-ピペリジルメチルオキシ基、3-ピペリジルメチルオキシ基、4-ピペリジルメチルオキシ基、1-メチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-メチルチアゾリン-4-イルオキシ基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルメチルオキシ基、ピペリジノカルボニルメチルオキシ基、2-メチルチアゾール-4-イル基、(2-メチルチアゾール-4-イル)メチルオキシ基、(2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル)メチルオキシ基、ベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-クロロベンジルアミノ基、3, 5-ジクロロベンジルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-ピリジルメチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、4-クロロベンゾイルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ基、3, 5-ジクロロベンゾイルアミノ基、3-ニトロ-4-メトキシベンゾイルアミノ基、4-ニトロ-3-メトキシベンゾイルアミノ基、3-ピリジカルボニルアミノ基、4-メチルフェニルスルホニルアミノ基、2-チアゾリルアミノスルホニル基、2-ピリジルアミノスルホニル基、ベンジルアミノカルボニル基、N-ベンジル-N-メチルアミノカルボニル基、(4-ピリジルメチル)アミノカルボニル基又は(シクロヘキシルメチル)アミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、3-ヒドロキシプロピルオキシ基、3-ヒドロキシピロリジニルカルボニル基、3-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、3, 4-ジヒドロキシピペリジノカルボニル基、4-メトキシピペリジノカルボニル基、4-カルボキシピペリジノカルボニル基、4-(ヒドロキシメチル)ピペリジノカルボニル基、2-オキソピペリジノカルボニル基、4-オキソピペリジノカルボニル基、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジノカルボニル基、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、1-オキソチオモルホリン-4-イルカルボニル基、1, 1-ジオキソチオモルホリン-4-イルカルボニル基、

1- (メチルスルホニル) ピペリジン-4-イルアミノカルボニル基、4-メチルスルホニルピペラジニルカルボニル基、N, N-ビス (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、シクロヘキシルアミノカルボニル基、4-ヒドロキシシクロヘキシルアミノカルボニル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチルアミノカルボニル基、2- (4-ヒドロキシピペリジノ) エチルオキシ基、2-ピリジルメチルアミノカルボニル基、3-ピリジルメチルアミノカルボニル基、N-メチル-N- (4-ピリジルメチル) アミノカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシ基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニルメチルオキシ基又は4-メチルチアゾール-2-イルメチルオキシ基である。

具体的な置換基として特に好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、ヒドロキシメチル基、カルボキシ基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、 (2-ヒドロキシルエチル) アミノカルボニル基、 (カルボキシメチル) アミノカルボニル基、メトキシ基、2-イソペンテニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、メチルチオ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルスルホニル基、アミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、tert-ブチルアミノスルホニル基、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4- (メトキシメチル) フェニル基、4- (2-ヒドロキシルエチル) フェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4- (ジメチルアミノカルボニル) フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、ベンジル基、フェネチル基、ベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-チアゾリル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、4-ピリジルメチルオキシ、2-ピペリジルメチルオキシ基、3-ピペリジルメチルオキシ基、4-ピペリジルメチルオキシ基、1-メチルピペリジン-4-イルメチ

ルオキシ基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-クロロピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-メチルチアゾール-4-イル基、(2-メチルチアゾール-4-イル)メチルオキシ基、(2,4-ジメチルチアゾール-5-イル)メチルオキシ基、5-テトラゾリル基、3-フルオロベンゾイル基、ピペリジノカルボニル基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、モルホリノカルボニル基、4-チオモルホリニルカルボニル基、ベンジルアミノカルボニル基、N-ベンジル-N-メチルアミノカルボニル基、(4-ピリジルメチル)アミノカルボニル基又は(シクロヘキシルメチル)アミノカルボニル基である。

具体的な置換基として最も好ましくは、フッ素原子、塩素原子、メチル基、ヒドロキシメチル基、カルボキシ基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メトキシ基、メチルアミノ基、アセチルアミノ基、アミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、tert-ブチルアミノスルホニル基、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-カルボキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基である。

またwとして好ましくは1又は2であり、r、tにおいて好ましくは0、1又は2であり、特に好ましくは0又は1であり、更に好ましくは0であり、pとして好ましくは1であり、qとして好ましくは0又は2である。

また、「製薬上許容されるその塩」とは、上記一般式[I]又は[II]で示される化合物と無毒の塩を形成するものであればいかなる塩でもよく、例えば塩酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸等の無機酸；又はシュウ酸、マロン酸、クエン酸、フマル酸、乳酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、グルコン酸、アスコルビン酸、メチルスルホン酸、ベンジルスルホン酸等の有機酸；又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、

水酸化アンモニウム等の無機塩基；又はメチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、トリエタノールアミン、エチレンジアミン、トリス（ヒドロキシメチル）メチルアミン、グアニジン、コリン、シンコニン等の有機塩基；又はリジン、アルギニン、アラニン等のアミノ酸と反応させることにより得ることができる。なお、本発明においては各化合物の含水物或いは水和物及び溶媒和物も包含される。

また、上記一般式〔I〕又は〔II〕で示される化合物においては、種々の異性体が存在する。例えば、幾何異性体としてE体及びZ体が存在し、また、不斉炭素原子が存在する場合は、これらに基づく立体異性体としての鏡像異性体及びジアステレオマーが存在する。場合によっては互変異性体が存在し得る。従って、本発明の範囲にはこれらすべての異性体及びそれらの混合物が包含される。

なお、本発明においては各化合物のプロドラッグ及び代謝物も包含される。

「プロドラッグ」とは、化学的又は代謝的に分解し得る基を有し、生体に投与された後、元の化合物に復元して本来の薬効を示す本発明化合物の誘導体であり、共有結合によらない複合体及び塩を含む。

本発明化合物を医薬製剤として用いる場合、通常それ自体公知の製薬上許容される担体、賦形剤、希釈剤、増量剤、崩壊剤、安定剤、保存剤、緩衝剤、乳化剤、芳香剤、着色剤、甘味剤、粘稠剤、矯味剤、溶解補助剤、その他添加剤、具体的には水、植物油、エタノール又はベンジルアルコール等のアルコール、ポリエチレングリコール、グリセロールトリアセテート、ゼラチン、ラクトース、デンプン等の炭水化物、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ラノリン、ワセリン等と混合して、常法により錠剤、丸剤、散剤、顆粒、坐剤、注射剤、点眼剤、液剤、カプセル剤、トローチ剤、エアゾール剤、エリキシル剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤等の形態となすことにより、全身的或いは局所的に、経口若しくは非経口で投与することができる。

投与量は年齢、体重、症状、治療効果、投与方法等により異なるが、通常、成人ひとり当たり、1回に0.1mg乃至1gの範囲で、1日1回乃至数回が投与される。

「C型肝炎の予防」とは、例えば検査等によりHCVが検出された人であって

C型肝炎の症状が現われていない人に対し薬剤を投与すること、或いはC型肝炎の治療後、肝炎の症状が改善された人であってHCVが根絶されておらず肝炎の再発が懸念される人に対し薬剤を投与することが挙げられる。

次に、本発明を実施するために用いる化合物の製造方法の一例を説明する。しかしながら、本発明化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

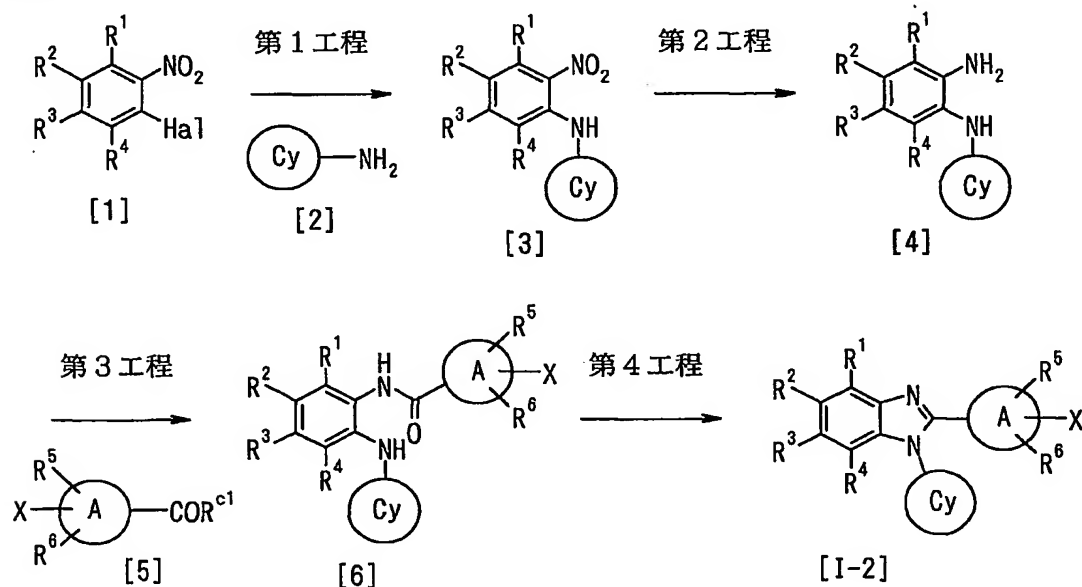
本製法に記載はなくとも、必要に応じて官能基に保護基を導入し後工程で脱保護を行う、各製法及び工程の順序を入れ替えるなどの工夫により効率よく製造を行えばよい。

また、各工程において、反応後の処理は通常行われる方法で行えばよく、単離精製、結晶化、再結晶化、シリカゲルクロマトグラフィー、分取HPLC等の慣用される方法を適宜選択し、また組み合わせて行えばよい。

製法 1

本製法は、ニトロベンゼン化合物からベンゾイミダゾール化合物を形成する方法である。

製法 1-1



(式中、Ha1は塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を示し、R^{c1}は塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子又は水酸基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

第1工程

常法により得られる若しくは市販の化合物〔1〕を、N，N－ジメチルホルムアミド（DMF）、アセトニトリル、テトラヒドロフラン（THF）、トルエン等の溶媒中、炭酸カリウム、トリエチルアミン、カリウム　　トートキシド等の塩基の存在下、或いは非存在下、室温又は加熱条件下で、アミン化合物〔2〕と反応させることにより化合物〔3〕を得ることが出来る。

第2工程

化合物〔3〕をメタノール、エタノール、THF、酢酸エチル、酢酸、水等の溶媒中、パラジウム炭素、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等の触媒の存在下、室温又は加熱条件下で水素化することにより化合物〔4〕を得ることが出来る。また、化合物〔3〕を亜鉛、鉄、塩化第一スズ、亜硫酸ナトリウム等の還元剤で還元する、或いは塩化第二鉄の存在下、ヒドラジンと反応させることにより化合物〔4〕を得ることも出来る。

第3工程

化合物〔4〕を、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミドや、1－エチル－3－（3－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤及び必要に応じてN－ヒドロキシスクシンイミド、1－ヒドロキシベンゾトリアゾール等を加えて、カルボン酸化合物〔5〕と縮合することによりアミド化合物〔6〕を得ることが出来る。また、カルボン酸化合物〔5〕を塩化チオニル、塩化オキサリル等で誘導される酸ハライドとする、或いは、クロロ炭酸エチル等により誘導される混合酸無水物とする等により化合物〔5〕の活性化エステルとし、次いで、トリエチルアミン、炭酸カリウム、ピリジン等の塩基存在下、或いはピリジン等のアミン溶媒中で反応させることによりアミド化合物〔6〕を得ることも出来る。

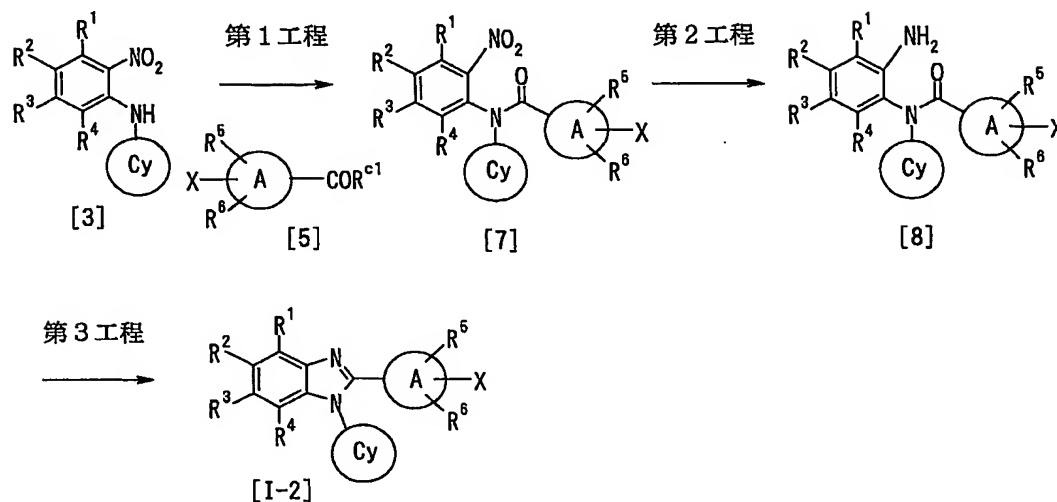
第4工程

化合物〔6〕をエタノール、メタノール、トルエン、DMF、クロロホルム等の溶媒中若しくは無溶媒中、酢酸、ギ酸、塩酸、希硫酸、リン酸、ポリリン酸、p－トルエンスルホン酸等の酸や塩化亜鉛、オキシ塩化リン、塩化チオニル等の

ハロゲン化剤或いは無水酢酸等の酸無水物の存在下、加熱し環化反応させることにより化合物[I-2]を得ることが出来る。

製法 1-2

本製法は、化合物[I-2]を製造する別法である。



(式中、各記号は前述の通りである。)

第1工程

製法1-1の第1工程と同様にして得られる化合物[3]を、製法1-1の第3工程と同様の方法で化合物[5]とアミド縮合することにより、化合物[7]を得ることができる。

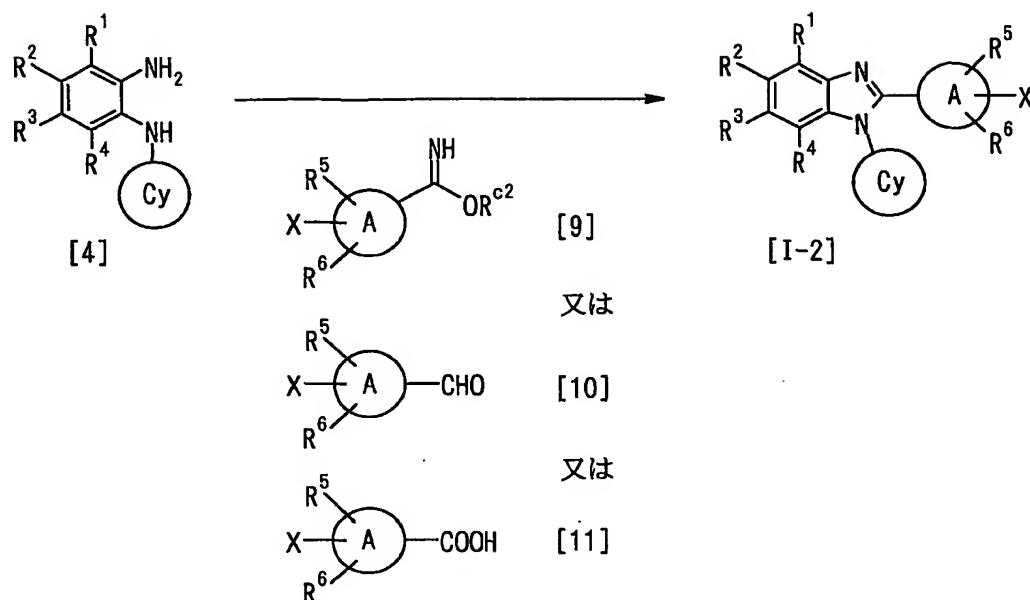
第2工程

化合物[7]を製法1-1の第2工程と同様の方法で還元することにより、化合物[8]を得ることができる。

第3工程

化合物[8]を製法1-1の第4工程と同様の方法で環化することにより、化合物[I-2]を得ることができる。

製法 1-3



(式中、 R^{c2} はメチル基、エチル基等のアルキル基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

化合物[4]をイミダート化合物[9]と、メタノール、エタノール、酢酸、DMF、THF、クロロホルム等の溶媒中、室温又は加熱条件下で反応させることにより化合物[I-2]を得ることが出来る。

また、化合物[4]を、酢酸、ぎ酸、アセトニトリル、DMF、ニトロベンゼン、トルエン等の溶媒中、ベンゾフロキサン、二酸化マンガン、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノ-p-ベンゾキノン、ヨウ素、フェリシアン酸カリウム等の酸化剤の存在下或いは非存在下で、加熱下、アルデヒド化合物[10]と反応させることにより化合物[I-2]を得ることも出来る。

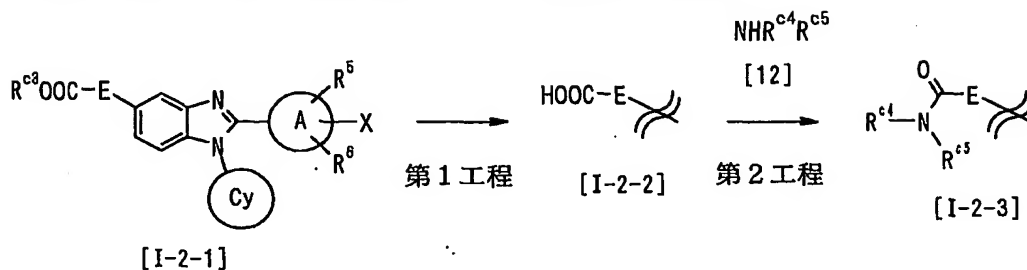
或いは、化合物[4]とカルボン酸化合物[11]を、ポリリン酸、リン酸、オキシ塩化リン、塩酸等存在下で直接加熱反応することにより化合物[I-2]を得ることも出来る。

製法 2

本製法では、ベンゾイミダゾールのベンゼン環上の置換基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 の変換方法を示す。なおここでは、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子である場合の R^2 の変換方法を示すが、本製法は置換位置に依らず用いることができる。

製法 2 - 1

カルボン酸エステル部位をアミドへ変換する方法。



{式中、Eは単結合、 $-(\text{CH}_2)_s-$ 、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_s-$ 又は $-\text{NH}-(\text{CH}_2)_s-$ （ここで、sは1乃至6の整数である。）であり、 R^{c3} 、 R^{c4} 及び R^{c5} は、 C_{1-6} アルキル基であり、その他各記号は前述の通りである。}

第1工程

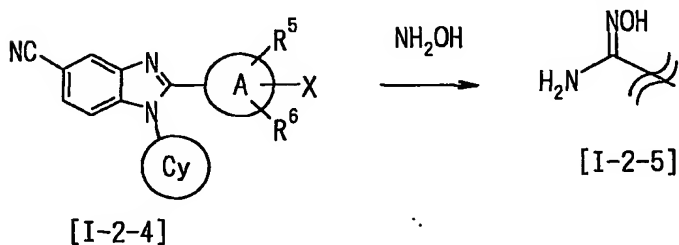
上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-1] を、メタノール、エタノール、THF、ジオキサン等の溶媒中、若しくはそれら溶媒と水との混合溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム等の塩基性条件下、或いは、塩酸、硫酸等の酸性条件下で加水分解することにより化合物 [I-2-2] を得ることが出来る。

第2工程

化合物 [I-2-2] を、製法 1 - 1 の第3工程と同様の方法で化合物 [12] と反応させることにより、化合物 [I-2-3] を得ることが出来る。

製法 2 - 2

シアノ基を置換アミジノ基へ変換する方法。



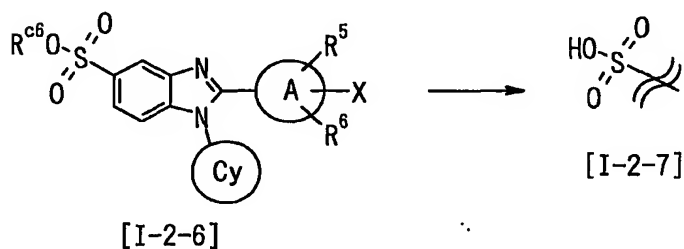
(式中、各記号は前述の通りである。)

上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-4] を、水、メタノール、エタノール、THF、DMF等の溶媒中、ヒドロキシルアミンと反応させることにより化

化合物 [I-2-5] を得ることが出来る。ヒドロキシルアミンの塩酸塩等の塩を用いる場合は、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、トリエチルアミン等の塩基の存在下で反応を行えばよい。

製法 2 - 3

スルホン酸エステル部位をスルホン酸へ変換する方法。



(式中、 R^{c6} は C_{1-6} アルキル基であり、その他各記号の定義は前述の通りである。)

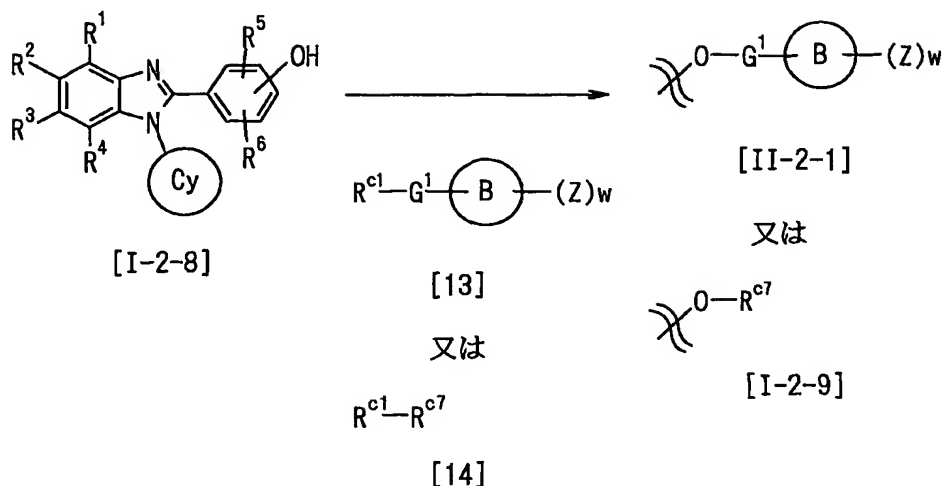
上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-6] を、DMF、ジメチルスルホキシド (DMSO)、アセトニトリル、メタノール、エタノール、水等の溶媒中、ヨウ化ナトリウム、ヨウ化リチウム等のヨウ化物塩、臭化ナトリウム、トリメチルアンモニウムブロミド等の臭化物塩、ピリジン、トリメチルアミン、トリアゾール等のアミン、トリフェニルホスフィン等のホスフィンと加熱下、反応させることにより [I-2-7] を得ることが出来る。

製法 3

本製法は、ベンゾイミダゾールの 2 位に置換するフェニル基上の置換基を変換する方法である。なお、フェニル基が他の環であっても本製法を用いることができる。

製法 3 - 1

水酸基をエーテルに変換する方法。



{式中、R^{a7}はR^{a11}に対応する置換されてもよいアルキル基であり、G¹は単結合、
-(CH₂)_n-(、-(CH₂)_n-O-(、*-(CH₂)_n-CO-又は*-(CH₂)_n-C
R^{a15}R^{a16})-(CH₂)_n-を示し、ここで*はR^{c1}に結合する側を示し、その他各記
号の定義は前述の通りである。}

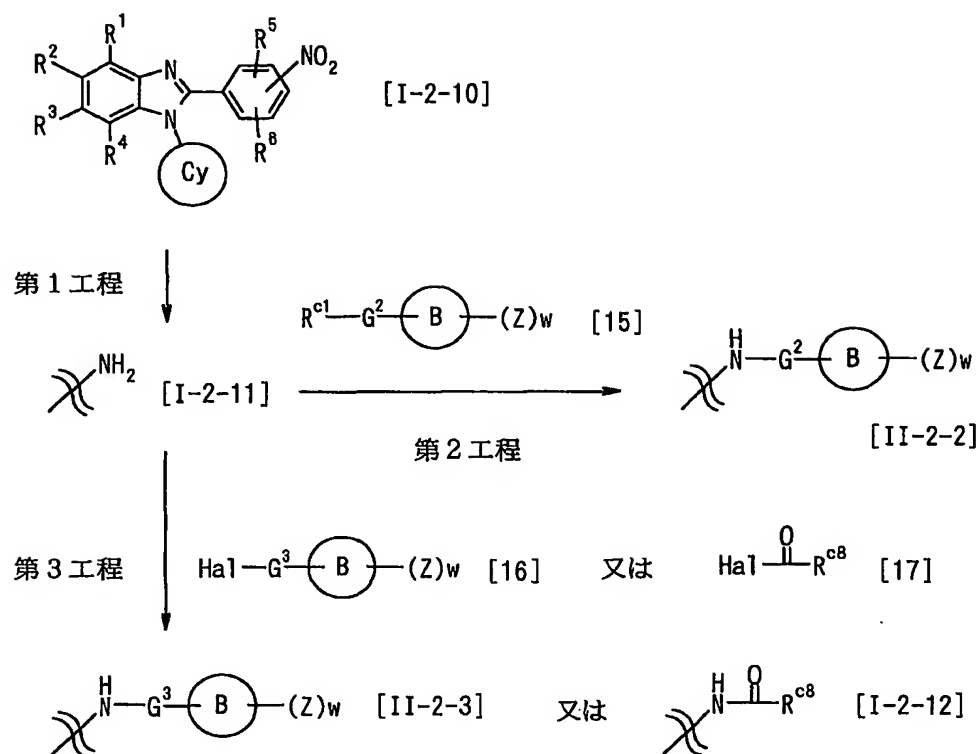
化合物 [13] において R^{01} がハロゲン原子である場合、上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-8] を、DMF、DMSO、アセトニトリル、エタノール、THF等の溶媒中、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、化合物 [13] と反応させることにより化合物 [II-2-1] を得ることが出来る。

また、化合物 [13] において R^{el} が水酸基である場合、化合物 [13] の水酸基を、塩化チオニル、三臭化リン、四臭化炭素ートリフェニルホスフィン等でハロゲン原子に変えた後、前述の方法で化合物 [I-2-8] と反応させることにより化合物 [II-2-1] を得ることが出来る。また、この場合、化合物 [I-2-8] を、DMF、アセトニトリル、THF等の溶媒中、トリフェニルホスフィン—アゾジカルボン酸ジエチル等により化合物 [13] と光延反応をさせることにより化合物 [II-2-1] を得ることも出来る。

同様にして化合物 [I-2-8] 及び化合物 [14] より化合物 [I-2-9] を得ることが出来る。

製法 3-2

ニトロ基を置換アミノ基に変換する方法。



{式中、 R^{c8} は C_{1-6} アルキル基を示し、 G^2 は $*-(CH_2)_n-$ 又は $*-CHR^{a15}-$ を示し、 G^3 は $-CO-$ 、 $*-CO_2-$ 、 $*-CONH-$ 又は $-SO_2-$ を示し、その他各記号は前述の通りである。}

第 1 工程

上記製法と同様にして得られるニトロ化合物 [I-2-10] から、製法 1-1 の第 2 工程と同様の方法で反応を行うことにより化合物 [I-2-11] を得ることが出来る。

第 2 工程

化合物 [I-2-11] を、製法 3-1 と同様の方法により化合物 [15] でアルキル化することにより化合物 [II-2-2] を得ることが出来る。

第 3 工程

化合物 [16] において G^3 が $-CO-$ 、 $-CO_2-$ 及び $-CONH-$ の場合、化

化合物 [I-2-11] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [16] でアシル化することにより化合物 [II-2-3] を得ることが出来る。

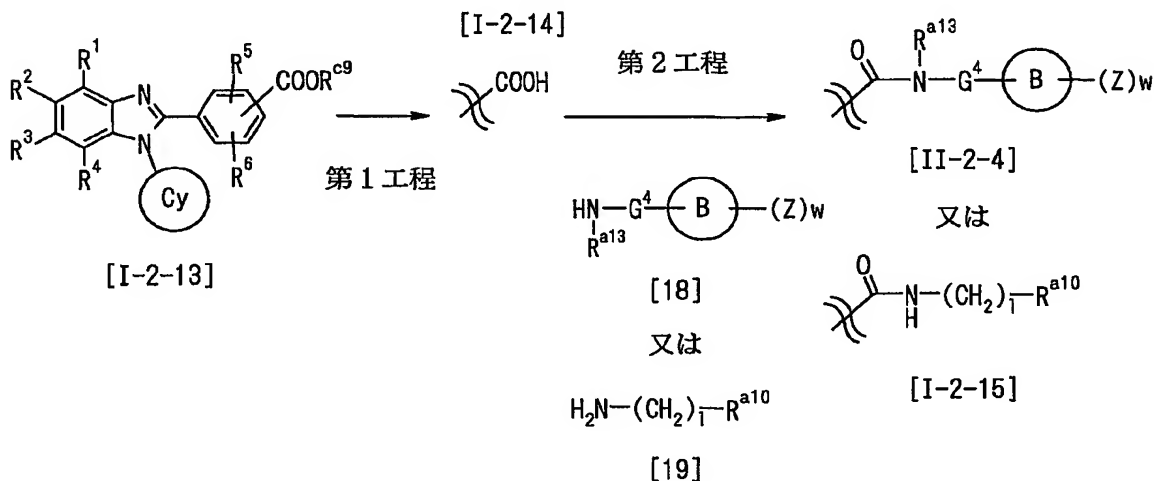
また、化合物 [16] において G^3 が $-SO_2-$ の場合、製法 1-1 の第 3 工程で用いた酸ハロゲン化物に換えてスルホニルハライドを用いてスルホニル化することにより、化合物 [II-2-3] を得ることが出来る。

同様にして化合物 [I-2-11] を、化合物 [17] でアシル化することにより化合物 [I-2-12] を得ることが出来る。

また、同様にして本製法を用いることにより化合物 [II-2-2]、化合物 [II-2-3] 及び化合物 [I-2-12] のジ置換体（三級アミン）を得ることが出来る。

製法 3-3

カルボン酸エステル部位をアミドに変換する方法。



(式中、 R^{c9} は C_{1-6} アルキル基を示し、 G^4 は $\#-(CH_2)_n-$ 、 $\#-(CH_2)_n-NH-$ 、 $\#-CHR^{a14}-$ を示し、ここで $\#$ は反応するアミンに結合する側を示し、その他各記号は前述の通りである。)

第 1 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-13] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で反応させることにより、化合物 [I-2-14] を得ることが出来る。

第 2 工程

化合物 [I-2-14] を製法 2-1 の第 2 工程と同様の方法で化合物 [18] と反応させることにより、化合物 [II-2-4] を得ることが出来る。

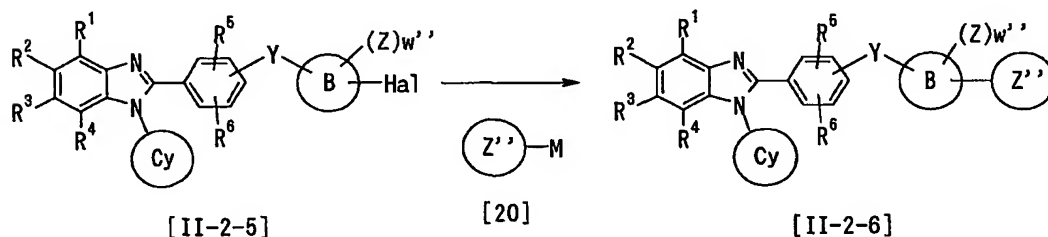
また同様にして化合物 [I-2-14] 及び化合物 [19] より化合物 [I-2-15] を得ることが出来る。

製法 4

本製法は、ベンゾイミダゾールの 2 位に置換するフェニル基上の環 B に対し、更に置換基を導入する方法である。なお、フェニル基が他の環であっても本製法を用いることができる。

製法 4-1

環 B に更に環 Z' を直結させる方法。

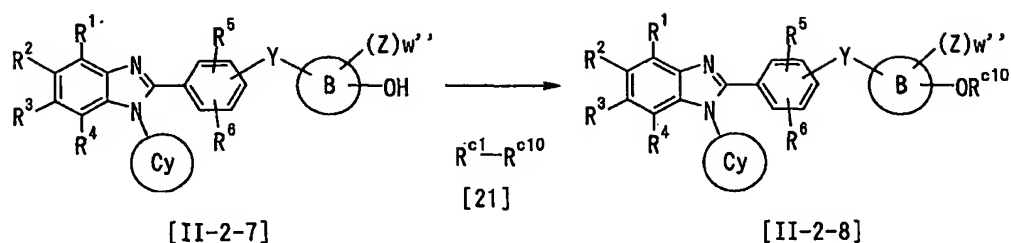


(式中、環 Z' - M はアリール金属化合物を示し、環 Z' 部位は置換基 Z に対応する置換されてもよい C₆₋₁₄ アリール基、置換されてもよいヘテロ環基、金属部位にはホウ素、亜鉛、スズ、マグネシウム等が含まれ、例えばフェニルボロン酸であり、w' は 0、1 又は 2 であり、その他各記号は前述の通りである。)

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-5] を、DMF、アセトニトリル、1, 2-ジメトキシエタン、THF、トルエン、水等の溶媒中、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、ビストリフェニルホスフィンパラジウム(II)ジクロリド、酢酸パラジウム-トリフェニルホスフィン等のパラジウム触媒や、塩化ニッケル、塩化 1, 3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパンニッケル(II)等のニッケル触媒、及び炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、アリール金属化合物 [20] と反応させることにより化合物 [II-2-6] を得ることが出来る。

製法 4-2

水酸基をエーテルに変換する方法。

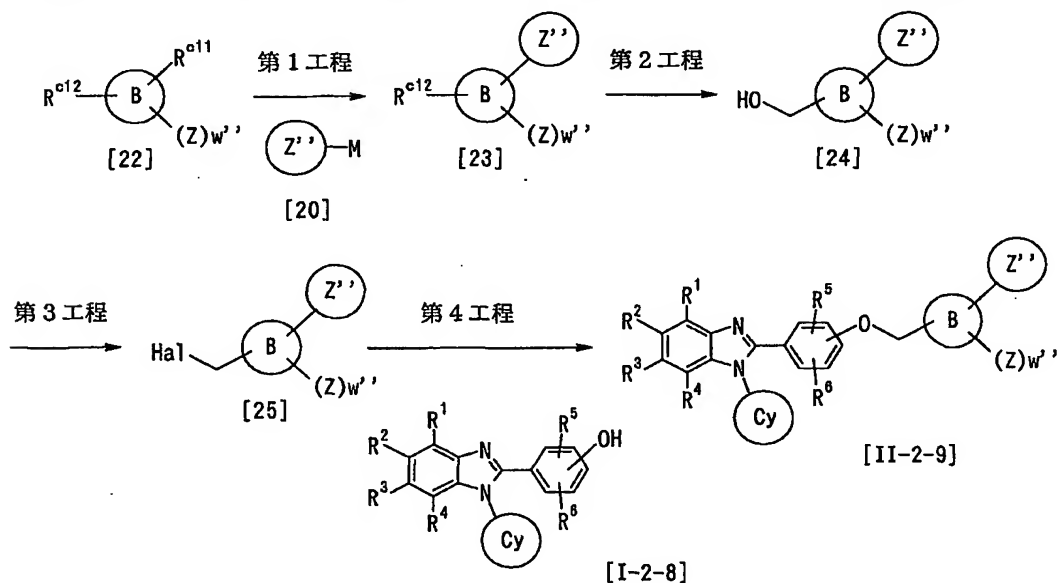


(式中、 R^{c10} は置換基Zに対応する $-R^{a20}$ 又は $-(CH_2)_p-COR^{a21}$ を示し、その他各記号は前述の通りである。)

上記製法で得られる化合物 [II-2-7] から、製法 3-1 の方法と同様にして化合物 [21] と反応させることにより、化合物 [II-2-8] を得ることが出来る。

製法 4-3

製法 3-1 における化合物 [13] の様な環 B パーツを、予め合成する方法。



(式中、 R^{c11} は臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基であり、 R^{c12} はホルミル基、カルボキシル基或いはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等のカルボン酸エステルを示し、その他各記号は前述の通りである。)

第1工程

市販若しくは常法により得られる化合物 [22] を、製法 4-1 と同様の方法で

アリール金属化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [23] を得ることが出来る。

第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [23] を、常法により還元することにより、化合物 [24] を得ることが出来る。

例えば、化合物 [23] を、メタノール、エタノール、THF等の溶媒中、水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム等の還元剤の存在下、冷却乃至加熱条件下で反応させることにより化合物 [24] を得ることが出来る。

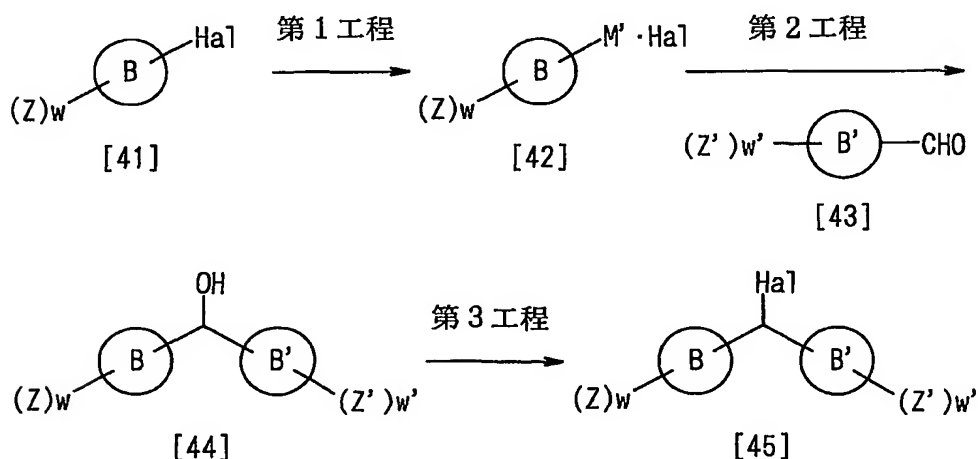
第3工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [24] を、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、ジクロロメタン、クロロホルム、トルエン等の溶媒中、五塩化リン、三臭化リン等のハロゲン化リン又は塩化チオニル等のハロゲン化剤と、ピリジン等の三級アミンの存在下若しくは加熱下で反応させることにより、化合物 [25] を得ることが出来る。

第4工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [24] 又は [25] を、製法3-1と同様の方法で化合物 [I-2-8] と反応させることにより、化合物 [II-2-9] を得ることが出来る。

製法4-4



(式中、M' はマグネシウム、リチウム、亜鉛等の金属であり、各記号は前述の

通りである。)

第1工程

市販若しくは常法により得られる化合物[41]を、常法によりアリール金属試薬とすることにより、化合物[42]を得ることが出来る。

例えば、M' がマグネシウムの場合、マグネシウムをTHF、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、冷却乃至加熱条件下、好ましくは-100乃至100℃で化合物[41]と反応させることにより、化合物[42]を得ることが出来る。

第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物[42]を化合物[43]と反応させることにより、化合物[44]を得ることが出来る。

化合物[42]を、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン、THF等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、冷却乃至室温条件下、好ましくは-100乃至30℃で反応させることにより、化合物[44]を得ることが出来る。

第3工程

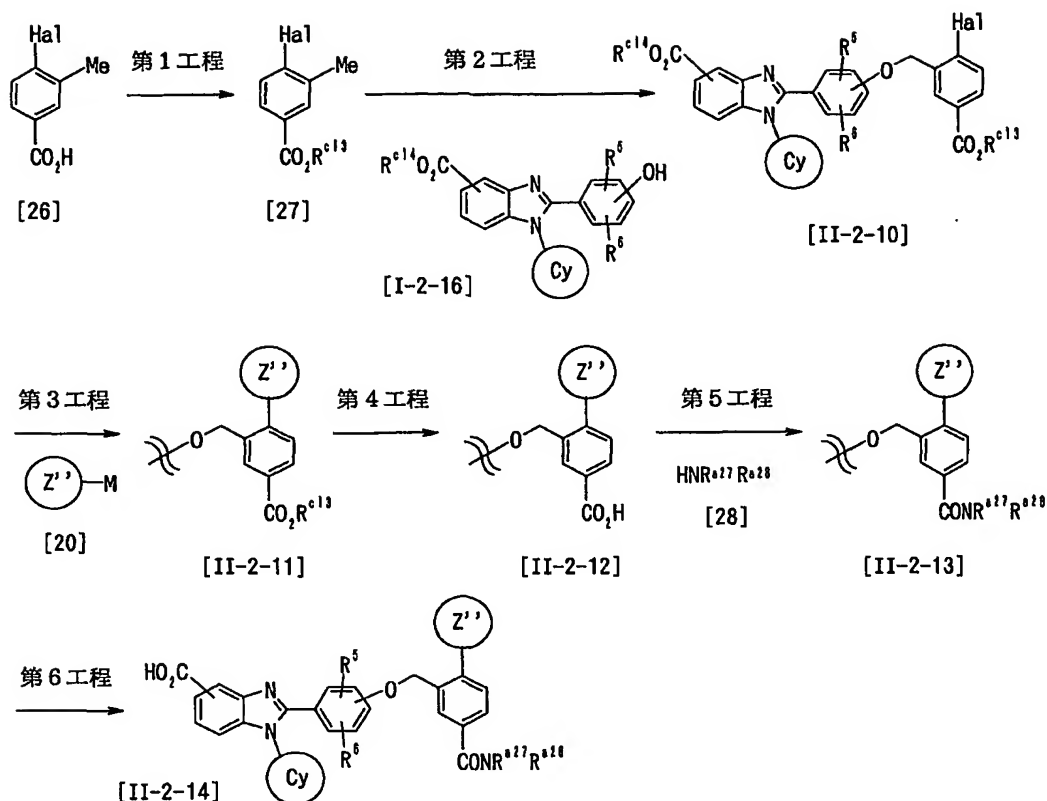
上記製法と同様にして得られる化合物[44]を、製法4-3の第3工程と同様の方法でハロゲン化することにより、化合物[45]を得ることが出来る。

化合物[44]を、好ましくはトルエン溶媒中、塩化チオニル及びピリジンで反応させることにより化合物[45]を得ることが出来る。

化合物[45]が対称形の場合、すなわち、環B-(Z)_w部分と環B'-(Z')_{w'}部分が同一の場合、化合物[42]を、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン、THF等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、ギ酸メチル、ギ酸エチル等のギ酸エステル、好ましくはギ酸エチルと、冷却乃至室温条件下、好ましくは-100乃至30℃で反応させることにより、化合物[45]を得ることが出来る。

製法4-5

官能基への保護基を導入する工程を含んだ方法。



(式中、 R^{c13} はtert-ブチル基等のカルボン酸保護基であり、 R^{c14} はメチル基等のカルボン酸保護基であり、その他各記号は前述の通りである。)

第1工程

市販若しくは既知の方法により得られる化合物 [26] に常法により保護基を導入することにより、化合物 [27] を得ることが出来る。

例えば、 R^{c13} がtert-ブチル基の場合、化合物 [26] を、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、トルエン等の溶媒中、塩化チオニル、塩化オキサリル等で誘導される酸ハライドとし、カリウムtert-ブトキシドと反応させることにより化合物 [27] を得ることが出来る。

ここで、 R^{c13} は第2、第3工程によって脱離せず、また、第4工程によって CO_2R^{c14} に影響を与えず脱離される保護基であれば他の保護基であってもよい。

第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [27] のメチル基をN-プロモこはく酸イミド、N, N'-アゾビスイソブチロニトリルでプロモメチル基に変換した後、

製法 3-1 と同様の方法で化合物 [I-2-16] と反応させることにより、化合物 [I-2-10] を得ることが出来る。

第 3 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-10] を、製法 4-1 と同様の方法でアリール金属化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [II-2-11] を得ることが出来る。

第 4 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-11] の R^{c13} を、常法により脱離させることにより、化合物 [II-2-12] を得ることが出来る。

カルボン酸保護基の脱離は、保護基に応じた通常の脱保護法を用いればよいが、本工程では R^{c14} が反応しない条件が望ましい。例えば、 R^{c13} が *tert*-ブチル基の場合、化合物 [II-2-11] を、ジクロロメタン、クロロホルム等の溶媒中、トリフルオロ酢酸で処理することにより化合物 [II-2-12] を得ることが出来る。

第 5 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-12] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [28] とアミド縮合させることにより、化合物 [II-2-13] を得ることが出来る。

第 6 工程

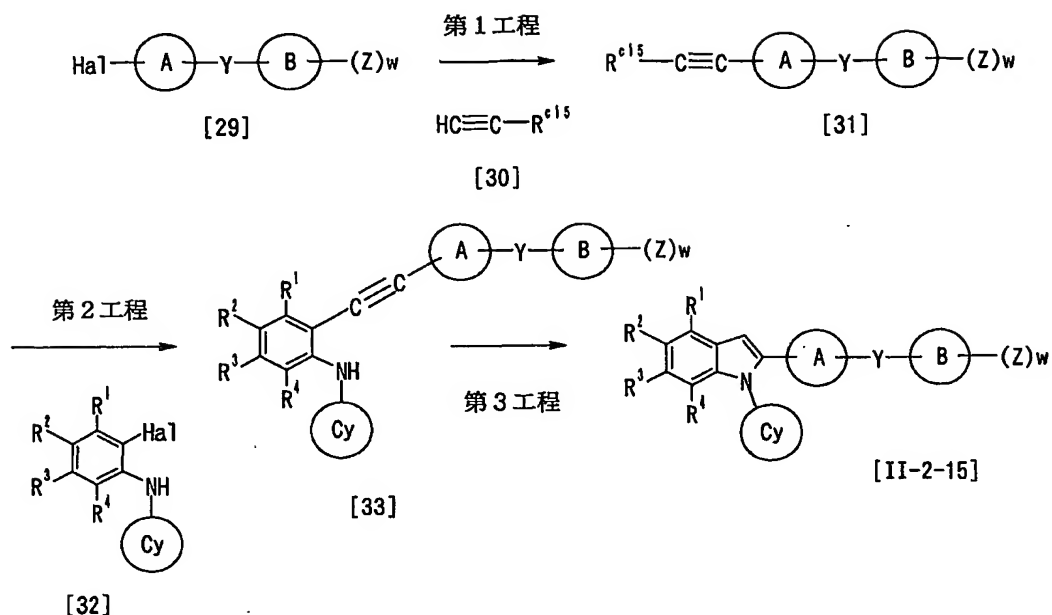
上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-13] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で脱保護させることにより、化合物 [II-2-14] を得ることが出来る。

ここで、 R^{c14} は第 1 乃至 5 工程によって反応を示さず、本工程によって脱離される保護基が望ましい。

例えば、 R^{c14} がメチル基のとき、化合物 [II-2-13] をメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒若しくはアルコール溶媒と水との混合溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基の存在下、冷却乃至加熱下で反応させ脱保護した後、溶液を酸性にすることにより化合物 [II-2-14] を得ることが出来る。

製法 5

インドール環を形成する方法。



(式中、 R^{C15} はトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基、tert-ブチルジフェニルシリル基等の保護基であり、その他各記号は前述の通りである。)

第1工程

上記製法若しくは常法により得られる化合物 [29] を、DMF、アセトニトリル、1,2-ジメトキシエタン、THF、トルエン、水等の溶媒中、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド、酢酸パラジウム-トリフェニルホスフィン等のパラジウム触媒、ヨウ化銅(I)等の銅触媒若しくはそれらの混合物、及び炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、化合物 [30] と反応させることにより化合物 [31] を得ることが出来る。

第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [31] を、メタノール、エタノール等のアルコール溶媒、若しくはアルコール溶媒とDMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等との混

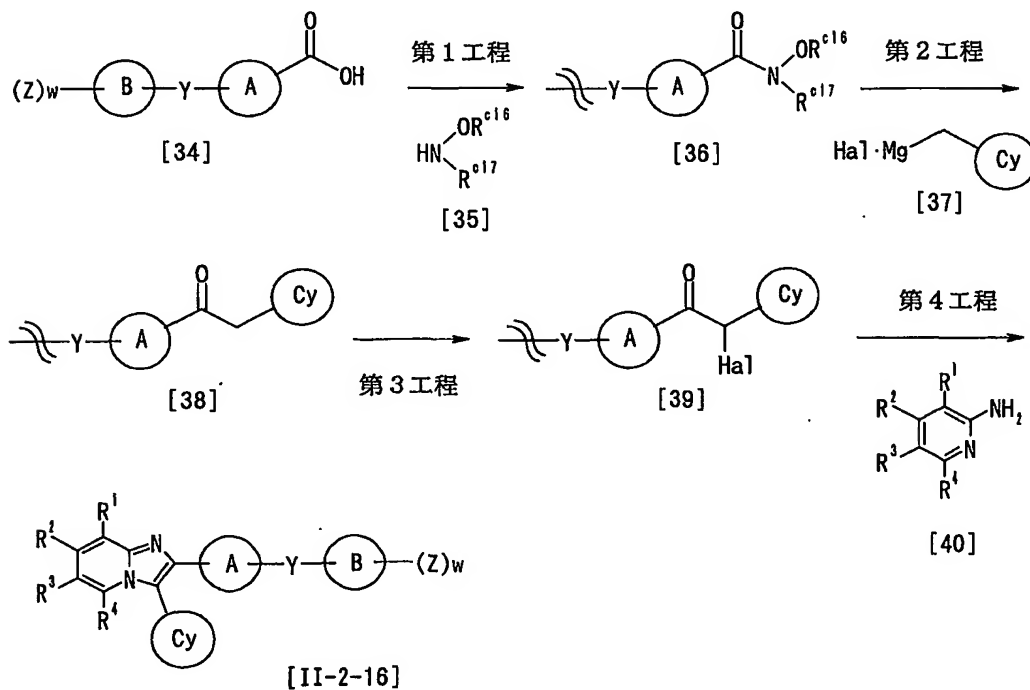
合溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の塩基の存在下、室温若しくは加熱下で反応させることにより保護基の脱離を行った後、製法 1-1 の第 1 工程と同様にして得られる化合物 [32] と製法 5 の第 1 工程と同様の方法で反応させることにより、化合物 [33] を得ることが出来る。

第 3 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [33] を、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ヨウ化銅(I)等の銅触媒若しくは塩化パラジウム(II)等のパラジウム触媒の存在下、室温又は加熱条件下で、環化反応させることにより、化合物 [I-2-15] を得ることが出来る。

製法 6

イミダゾ [1, 2-a] ピリジン環を形成する方法。



(式中、 R^{c16} 及び R^{c17} は、それぞれ独立して、メチル基、エチル基等のアルキル基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

第 1 工程

上記製法若しくは常法により得られる化合物 [34] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [35] とアミド縮合させることにより、化合物 [36] を得ることが出来る。

第 2 工程

上記製法により得られる化合物 [36] を、常法により得られるグリニャール試薬 [37] と反応させることにより、化合物 [38] を得ることが出来る。

ここで、化合物 [36] に代えて、化合物 [34] の酸ハライドを用いてもよい。

第 3 工程

上記製法により得られる化合物 [38] を、常法によりハロゲン化することにより、化合物 [39] を得ることが出来る。

例えば、Hal が臭素原子の場合、化合物 [38] を冷却若しくは室温条件下、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、トルエン等の溶媒中、臭素と反応させることにより化合物 [39] を得ることが出来る。

なお、臭素に換えて次亜塩素酸塩等の次亜ハロゲン酸塩、N-ブロモスクシンイミド等のハロゲン化剤を用いてハロゲン化することもできる。

第 4 工程

上記製法により得られる化合物 [39] を、常法若しくは既知の方法（特開平 8-48651 号）により得られる化合物 [40] と、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の塩基の存在下、室温又は加熱条件下、溶媒中若しくは無溶媒で環化反応させることにより、化合物 [II-2-16] を得ることが出来る。

上記製法 2 乃至 4 に示された製法は、一般式 [I] 及び [II] で表されるベンゾイミダゾール以外の化合物、例えば化合物 [II-2-15]、[II-2-16] の合成にも用いることが出来る。

次に、本発明に係る一般式 [I] 及び [II] で示される化合物及びその製造方法を実施例によって具体的に説明する。しかしながら、本発明はこれら実施例によって限定されるものではない。

実施例 1

2- [4- (3-ブロモフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾ
イミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1 : 4-クロロ-3-ニトロ安息香酸エチルの製造

4-クロロ-3-ニトロ安息香酸 (300g) をエチルアルコール (1500ml) に溶
解し、氷冷下濃硫酸 (100ml) を加え、7時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、
析出した結晶を濾取し、表題化合物 (332g, 収率97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 8.50 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.16 (1H, dd, $J=8.4, 2.1\text{Hz}$), 7.63 (1
H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 4.43 (2H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 1.42 (3H, t, $J=7.5\text{Hz}$)

工程 2 : 4-シクロヘキシルアミノ-3-ニトロ安息香酸エチルの製造

前工程で得られた 4-クロロ-3-ニトロ安息香酸エチル (330g) をアセトニ
トリル (1500ml) に溶解し、シクロヘキシルアミン (220g)、トリエチルアミン
(195g) を加え、終夜加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、析出した結晶を濾取
し、表題化合物 (400g, 収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 8.87 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.35-8.46 (1H, m), 8.02 (1H, dd, $J=9.$
1, 2.1Hz), 6.87 (1H, d, $J=9.1\text{Hz}$), 4.35 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 3.65-3.50 (1H, m), 2.14-1.29
(10H, m), 1.38 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

工程 3 : 3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチルの製造

前工程で得られた 4-シクロヘキシルアミノ-3-ニトロ安息香酸エチル (400
g) を酢酸エチル (1500ml)、エチルアルコール (500ml) に溶解し、7.5%パラジ
ウム炭素 (50% wet, 40g) を加え、7時間常圧水素添加した。触媒をろ別し、濾
液を減圧濃縮した。残渣にジイソプロピルエーテルを加え、析出した結晶を濾取
し、表題化合物 (289g, 収率80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 7.57 (1H, dd, $J=8.4, 1.9\text{Hz}$), 7.41 (1H, d, $J=1.9\text{Hz}$), 6.59 (1
H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 4.30 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 3.40-3.30 (1H, m), 2.18-2.02 (2H, m), 1.88-1.1
5 (8H, m), 1.35 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

工程 4 : 3- [4- (3-ブロモフェノキシ) ベンゾイル] アミノ-4-シクロ
ヘキシルアミノ安息香酸エチルエステルの製造

4- (3-ブロモフェノキシ) 安息香酸 (74g) をクロロホルム (500ml) に溶

解し、塩化オキサリル (33ml) 及びジメチルホルムアミド (触媒量) を加え室温で4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、ジクロロメタン (150ml) に溶解した。これを、前工程で得られた 3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル (66g) のジクロロメタン (500ml)、トリエチルアミン (71ml) 溶液に滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を、飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣に、ジエチルエーテルを加えて結晶化し、これを濾取して表題化合物 (129g, 収率95%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.00-7.78(4H, m), 7.66(1H, brs), 7.37-7.18(3H, m), 7.13-6.59(3H, m), 6.72(1H, d, J=8.7Hz), 4.50(1H, brs), 4.29(2H, q, J=7.2Hz), 3.36(1H, m), 2.12-1.96(2H, m), 1.83-1.56(3H, m), 1.47-1.12(5H, m), 1.37(3H, t, J=7.2Hz)

工程 5 : 2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた 3-[4-(3-プロモフェノキシ)ベンゾイル]アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチルエステル (129g) を酢酸 (600ml) に懸濁し、3時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮して、残渣に水を加え、析出した結晶を濾取し表題化合物 (124g, 収率99%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.51(1H, d, J=1.5Hz), 8.00(1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.67(1H, d, J=8.4Hz), 7.63(2H, d, J=8.7Hz), 7.35-7.21(3H, m), 7.17(2H, d, J=8.7Hz), 7.14(1H, m), 4.42(2H, q, J=7.2Hz), 4.38(1H, m), 2.43-2.22(2H, m), 2.07-1.87(4H, m), 1.80(1H, m), 1.42(3H, t, J=7.2Hz), 1.40-1.27(3H, m)

実施例 2

2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 1 で得られた 2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (1.0g) をテトラヒドロフラン (10ml)、エチルアルコール (10ml) に溶解し、4 N 水酸化ナトリウム (10ml) を加え、1時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、6 N 塩酸で酸性にし、析出した結晶を濾取して、表題化合物 (0.9g, 収

率96%)を得た。

融点:255-256°C

FAB-MS:491(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆):12.75(1H, brs), 8.24(1H, s), 7.96(1H, d, J=8.7Hz), 7.86(1H, d, J=8.7Hz), 7.71(2H, d, J=8.6Hz), 7.47-7.34(3H, m), 7.24(2H, d, J=8.6Hz), 7.20(1H, m), 4.31(1H, m), 2.38-2.18(2H, m), 2.02-1.79(4H, m), 1.65(1H, m), 1.44-1.20(3H, m)

実施例 3

1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例1の工程3で得られた3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル(130g)、メチル 4-ヒドロキシベンズイミデート塩酸塩(139g)をメチルアルコール(1500ml)に加え、4時間加熱還流した。反応液を放冷した後、析出した結晶を濾取し表題化合物(131g, 収率72%)を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃):10.02(1H, brs), 8.21(1H, d, J=1.4Hz), 7.93(1H, d, J=8.6Hz), 7.83(1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.48(2H, d, J=8.6Hz), 6.95(2H, d, J=8.6Hz), 4.39-4.25(1H, m), 4.33(1H, q, J=7.0Hz), 2.35-2.18(2H, m), 1.98-1.79(4H, m), 1.70-1.60(1H, m), 1.46-1.19(3H, m), 1.35(3H, t, J=7.0Hz)

実施例 4

2-[4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

2-ブロモ-5-クロロトルエン(50g)及びN-ブロモコハク酸イミド、N, N'-アゾビスイソブチロニトリルより調製した2-ブロモ-5-クロロベンジルブロミド及び、実施例3で得られた1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(50g)をジメチルホルムアミド(300ml)に懸濁し、炭酸カリウム(38g)を加え80°Cにて1時間加熱攪拌した。反応液を放冷し、水、酢酸エチル混合溶媒に加え、析出した結晶を濾取し、表題化合物(50g, 収率64%)を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃):8.50(1H, d, J=1.4Hz), 7.97(1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.70-7.

57(5H, m), 7.20(1H, dd, J=8.4, 2.5Hz), 7.14(2H, d, J=8.7Hz), 5.17(2H, s), 4.46-4.30(1H, m), 4.41(2H, q, J=7.1Hz), 2.40-2.20(2H, m), 2.02-1.21(8H, m), 1.42(3H, t, J=7.1Hz)

実施例 5

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 4 で得られた 2- [4- (2-ブromo-5-クロロベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (49g)、4-クロロフェニルボロン酸 (18g) 及びテトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム (10g) を 1, 2-ジメトキシエタン (600ml) に懸濁し、飽和重曹水 (300ml) を加え、2 時間加熱還流した。反応液にクロロホルムを加え、有機層を飽和重曹水、水、飽和食塩水にて順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 クロロホルム:酢酸エチル=97:3) で精製した。得られた油状物に、酢酸エチル及びジイソプロピルエーテルを加え、結晶化し、これを濾取して表題化合物 (44g, 収率85%) を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 8.49(1H, d, J=1.4Hz), 7.97(1H, dd, J=8.6, 1.6Hz), 7.70-7.60(2H, m), 7.55(2H, d, J=8.7Hz), 4.95(2H, s), 4.48-4.28(1H, m), 4.40(2H, m), 2.02-1.20(8H, m), 1.41(3H, t, J=7.1Hz)

実施例 6

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 5 で得られた 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (43g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (33g, 収率76%) を得た。

融点: 243-244°C

FAB-MS: 571(MH⁺)

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, DMSO- d_6): 8.32(1H, s), 8.28(1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 8.05(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.76-7.72(3H, m), 7.58-7.46(5H, m), 7.40(1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.24(2H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 5.11(2H, s), 4.36(1H, m), 2.40-2.15(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.95-1.75(2H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.55-1.15(3H, m)

実施例 7

2- [4- (2-プロモ-5-メトキシベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 4 と同様にして、実施例 3 で得られた 1-シクロヘキシル-2- (4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルと 2-プロモ-5-メトキシベンジルブロミドから表題化合物 (59g) を得た。

実施例 8

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 7 で得られた 2- [4- (2-プロモ-5-メトキシベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルから実施例 5 と同様の方法により表題化合物 (48g, 収率 77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 8.49(1H, d, $J=1.4\text{Hz}$), 7.97(1H, dd, $J=8.6, 1.4\text{Hz}$), 7.64(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.54(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.37(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.31(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.25(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.19(1H, d, $J=2.7\text{Hz}$), 7.00(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.97(1H, dd, $J=8.4, 2.7\text{Hz}$), 4.98(2H, s), 4.41(2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 4.42-4.29(1H, m), 3.88(3H, s), 2.40-2.20(2H, m), 2.01-1.88(4H, m), 1.83-1.73(1H, m), 1.42(3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.41-1.25(3H, m)

実施例 9

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 8 で得られた 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (52g) を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物

(44g, 収率89%)を得た。

融点:248-249°C

FAB-MS:568(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆):8.20(1H, s), 7.88(1H, d, J=8.7Hz), 7.85(1H, d, J=8.7Hz), 7.57(d, 2H, J=8.6Hz), 7.46(2H, d, J=8.6Hz), 7.44(2H, d, J=8.6Hz), 7.29(1H, d, J=8.5Hz), 7.24(1H, d, J=2.6Hz), 7.11(2H, d, J=8.6Hz), 7.06(1H, dd, J=8.5, 2.6Hz), 5.04(2H, s), 4.26(1H, m), 3.83(3H, s), 2.38-2.29(2H, m)

実施例 1.0

1-シクロヘキシル-2- {4- [(E)-2-フェニルビニル] フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例1の工程3で得られた3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル(500mg)をメチルアルコール(6ml)に溶解し、氷冷下、トランス-4-スチルベンカルボアルデヒド(397mg)を加え、室温にて終夜攪拌した。反応液を氷冷し、アセトニトリル(2ml)に溶解したベンゾフロキサソ(259mg)を加え、50°Cにて7時間攪拌した。反応液を氷冷し、1N水酸化ナトリウム(0.1ml)を加えた後、酢酸エチルを加えて抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー(展開溶媒 n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製し、表題化合物(540mg, 収率63%)を得た。

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆):8.28(1H, d, J=1.4Hz), 8.01(1H, d, J=8.7Hz), 7.90-7.80(3H, m), 7.75-7.65(4H, m), 7.50-7.25(5H, m), 4.35(2H, q, J=7.0Hz), 4.31(1H, m), 2.40-2.20(2H, m), 2.00-1.80(4H, m), 1.63(1H, m), 1.40-1.20(3H, m), 1.36(3H, t, J=7.0Hz)

実施例 1.1

1-シクロヘキシル-2- {4- [(E)-2-フェニルビニル] フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例1.0で得られた1-シクロヘキシル-2- {4- [(E)-2-フェニルビニル] フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(127mg)を用い、実施例2と同様の方法により、表題化合物(116mg, 収率97%)を

得た。

融点：300°C以上

FAB-*Ms*:423(*MH*⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-*d*₆): 8.25(1H, *s*), 7.96-7.29(13H, *m*), 4.33(1H, *brt*), 2.41-2.23(2H, *m*), 2.03-1.78(4H, *m*), 1.71-1.59(1H, *m*), 1.49-1.20(3H, *m*)

実施例 1 2

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸の製造

実施例 1 及び 2 と同様にして表題化合物 (700mg) を得た。

FAB-*Ms*:413(*MH*⁺)

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.60(1H, *s*), 8.04(1H, *d*, *J*=9.0Hz), 7.63(2H, *d*, *J*=8.4Hz), 7.51-7.32(6H, *m*), 7.14(2H, *d*, *J*=9.0Hz), 5.16(2H, *s*), 5.03-4.89(1H, *m*), 2.41-1.63(8H, *m*)

実施例 1 3

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミドの製造

実施例 1 2 で得られた 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (700mg) をジメチルホルムアミド (10ml) に溶解し、塩化アンモニウム (108mg)、1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 (390mg)、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (275mg) 及びトリエチルアミン (0.3ml) を加え室温にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、水、飽和食塩水にて順次洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣に、酢酸エチル及びジイソプロピルエーテルを加え、結晶化し、これを濾取して、表題化合物 (571mg, 収率81%) を得た。

融点: 232-233°C

FAB-*Ms*:412(*MH*⁺)

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.23(1H, *d*, *J*=1.5Hz), 7.86(1H, *dd*, *J*=8.5, 1.5Hz), 7.65-7.30(8H, *m*), 7.13(2H, *d*, *J*=8.8Hz), 5.16(2H, *s*), 4.93(1H, *quint*, *J*=8.8Hz), 2.40-1.60

(8H,m)

実施例 1 4

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールの製造

実施例 1 と同様にして表題化合物 (400mg) を得た。

FAB-MS:394(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃):8.11(1H,s),7.68-7.30(9H,m),7.13(2H,s),5.16(2H,s),4.94(1H,quint,J=8.9Hz),2.35-1.60(8H,m)

実施例 1 5

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミドオキシムの製造

実施例 1 4 で得られた 2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (400mg) をエチルアルコール (3ml)、水 (1.5ml) に懸濁し、ヒドロキシルアミン塩酸塩 (141mg) 及び重曹 (170mg) を加え、終夜加熱還流した。反応液を、放冷し析出した結晶を濾取して、表題化合物 (312mg, 収率71%) を得た。

融点:225-226°C

FAB-MS:456(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆):8.20(1H,s),7.50-7.31(9H,m),7.12(2H,d,J=8.7Hz),5.15(2H,s),4.94(1H,quint,J=8.7Hz),3.61(3H,s),3.40(3H,s),2.41-1.42(8H,m)

実施例 1 6

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1: 4-(4-フルオロフェニル)-5-ヒドロキシメチル-2-メチルチアゾールの製造

文献既知 (Chem. Pharm. Bull., 43(6), 947, 1995) の方法により調製した 4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾールカルボン酸エチルエステル (59g) をテトラヒドロフラン (700ml) に溶解し、氷冷下、水素化リチウ

ムアルミニウム (13g) を加え30分攪拌した。反応液に水 (13ml)、15%水酸化ナトリウム (13ml)、水 (39ml) を順次加え、析出した不溶物をろ別した。濾液を減圧濃縮し、表題化合物 (37g, 収率71%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 7.60(2H, dd, $J=8.7, 6.6\text{Hz}$), 7.11(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 4.80(2H, s), 2.70(3H, s)

工程2: 5-クロロメチル-4-(4-フルオロフェニル)-2-メチルチアゾールの製造

前工程で得られた4-(4-フルオロフェニル)-5-ヒドロキシメチル-2-メチルチアゾール (37g) をクロロホルム (500ml) に溶解し、塩化チオニル (24ml)、ピリジン (2ml) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄した。これを、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して表題化合物 (29g, 収率76%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 7.67(2H, dd, $J=8.8, 5.4\text{Hz}$), 7.16(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 4.79(2H, s), 2.73(3H, s)

工程3: 1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた5-クロロメチル-4-(4-フルオロフェニル)-2-メチルチアゾール (28g) 及び実施例3で得られた1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (36g) を用い、実施例4と同様の方法により表題化合物 (61g, 収率100%) を得た。

APCI- Ms : 570(MH $^+$)

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, $\text{DMSO}-d_6$): 8.25(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.97(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.86(1H, d, $J=8.6, 1.6\text{Hz}$), 7.74(2H, dd, $J=8.8, 5.5\text{Hz}$), 7.62(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.33(2H, t, $J=8.9\text{Hz}$), 7.22(2H, t, $J=8.9\text{Hz}$), 5.41(2H, s), 4.34(2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 4.31(1H, m), 2.71(3H, s), 2.40-2.15(2H, m), 2.05-1.75(4H, m), 1.55-1.15(3H, m), 1.36(3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

実施例17

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボ

ン酸

実施例 16 で得られた 1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (60g) を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物 (39g、収率69%) を得た。

融点: 196-198°C

FAB-MS: 542 (MH⁺)

¹H-NMR (300MHz, DMSO-d₆): 13.1 (1H, brs), 8.34 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.8Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80-7.72 (4H, m), 7.36-7.31 (4H, m), 5.46 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.72 (3H, s), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m)

実施例 18

1-シクロヘキシル-2- (2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 3 と同様にして表題化合物 (50g) を得た。

実施例 19

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1 : 3, 3'-ジフルオロベンズヒドロールの製造

マグネシウム片 (35.4g) の THF (200ml) 混合液にヨウ素片を加え、窒素気流攪拌下、ヨウ素の色がほぼ消えるまで加熱した。この溶液を内温60°Cに維持しながら、3-フルオロプロモベンゼン (250.0g) の THF (1000ml) 溶液を2.5時間で滴下した。滴下終了後、1時間加熱還流した。得られたグリニャール溶液を氷冷し、ギ酸エチル (63.2g) の THF (200ml) 溶液を1時間かけて滴下した。更に反応溶液を30分攪拌後、飽和塩化アンモニウム水溶液 (700ml) を氷冷攪拌下滴下し、水 (300ml) を加え、10分攪拌した。有機層と水層を分離し、水層を酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて2N塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去し、目的化

合物 (156.2g、収率99%) を得た。

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃):7.31(2H,td,J=7.9,5.8Hz),7.15-7.80(4H,m),6.97-6.94(2H,m),5.82(1H,d,J=3.3Hz),2.30(1H,d,J=3.3Hz)

工程 2 : 3, 3'-ジフルオロベンズヒドリルクロリドの製造

前工程で得られた 3, 3'-ジフルオロベンズヒドロール (150.0g) のトルエン溶液 (400ml) に、室温でピリジン (539mg) を加えた。この溶液に塩化チオニル (89.1g) を室温で 1 時間かけ滴下し、更に 2 時間攪拌した。内温が 40℃ になるように加熱し、更に 1.5 時間攪拌した。塩化チオニル (8.1g) を再度加え、30 分攪拌した。反応液に水を加え、有機層を分離し、これを水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去し、表題化合物 (158.2g、収率97%) を得た。

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃):7.32(2H,td,J=8.0,5.9Hz),7.18-7.10(4H,m),7.01(2H,td,J=8.2,2.5,1.2Hz),6.05(1H,s)

工程 3 : 2 - {4 - [ビス (3 - フルオロフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 18 で得られた 1 - シクロヘキシル - 2 - (2 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル (50g) 及び前工程により得られた 3, 3'-ジフルオロベンズヒドリルクロリド (34g) を用い、実施例 4 と同様の方法により、表題化合物 (76 g、収率99%) を得た。

FAB-MS:585(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz,DMSO-d₆):8.24(1H,d,J=1.4Hz),7.98(1H,d,J=8.7Hz),7.88(1H,d,J=8.7Hz),7.56(1H,t,J=8.6Hz),7.50-7.40(6H,m),6.82(1H,s),4.34(2H,q,J=7.1Hz),3.95(1H,m),2.20-2.10(2H,m),1.90-1.80(4H,m),1.6(1H,m),1.35(3H,t,J=7.2Hz),1.30-1.20(3H,mz)

実施例 20

2 - {4 - [ビス (3 - フルオロフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸の製造

実施例 19 で得られた 2 - {4 - [ビス (3 - フルオロフェニル) メトキシ]

ー 2 ーフルオロフェニル}ー 1 ーシクロヘキシルベンゾイミダゾールー 5 ーカルボン酸エチルエステル (75g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (48g, 収率62%) を得た。

融点: 242-243°C

FAB-MS: 557(MH⁺)

¹H-NMR (300MHz, DMSO-d₆): 8.29 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.8Hz), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, t, J=8.7Hz), 7.51-7.40 (6H, m), 7.30 (1H, d, J=12.1Hz), 7.20-7.14 (3H, m), 6.88 (1H, s), 4.07 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)

実施例 2 1

1 ーシクロペンチルー 2 ー (4 ーニトロフェニル) ベンゾイミダゾールー 5 ーカルボン酸エチルエステル

実施例 1 と同様にして表題化合物 (12g) を得た。

実施例 2 2

2 ー (4 ーアミノフェニル) ー 1 ーシクロペンチルベンゾイミダゾールー 5 ーカルボン酸エチルエステルの製造

実施例 2 1 で得られた 1 ーシクロペンチルー 2 ー (4 ーニトロフェニル) ベンゾイミダゾールー 5 ーカルボン酸エチルエステル (12g) をテトラヒドロフラン (200ml)、エチルアルコール (50ml) に溶解し、7.5%パラジウム炭素 (50% wet, 1g) を加え、1時間常圧水素添加した。触媒をろ別し、ろ液を減圧濃縮した。残渣にテトラヒドロフランを加え結晶化し、これを濾取して、表題化合物 (11g, 収率 98%) を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 8.49 (1H, d, J=1.3Hz), 7.95 (1H, dd, J=8.5, 1.3Hz), 7.50-7.40 (3H, m), 6.79 (2H, d, J=4.6Hz), 4.97 (1H, quint, J=8.9Hz), 4.40 (2H, q, J=7.1Hz), 3.74 (2H, brs), 2.40-1.60 (8H, m), 1.41 (3H, t, J=7.1Hz)

実施例 2 3

2 ー (4 ーベンゾイルアミノフェニル) ー 1 ーシクロペンチルベンゾイミダゾールー 5 ーカルボン酸エチルエステルの製造

実施例 2 2 で得られた 1 ーシクロペンチルー 2 ー (4 ーアミノフェニル) ベン

ゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (300mg) をピリジン (3ml)、クロロホルム (3ml) に溶解し、塩化ベンゾイル (127mg) を加え、室温にて30分攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加えて結晶化した。これを濾取して表題化合物 (403mg, 収率100%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.58(1H, s), 8.00(1H, d, J=9.0Hz), 7.84(2H, d, J=7.5Hz), 7.60-7.40(6H, m), 7.14(2H, d, J=7.5Hz), 4.84(1H, quint, J=8.7Hz), 4.41(2H, q, J=7.5Hz), 2.20-1.30(8H, m), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)

実施例 2 4

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸の製造

実施例 2 3 で得られた 2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (200mg) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表記化合物 (131mg, 収率70%) を得た。

融点: 300°C以上

FAB-MS: 426(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆): 10.75(1H, s), 8.35(1H, s), 8.15 and 7.85(4H, ABq, J=8.9Hz), 8.10-7.98(4H, m), 7.70-7.55(3H, m), 5.02(1H, quint, J=8.7Hz), 2.36-2.15(4H, m), 2.14-1.95(2H, m), 1.80-1.62(2H, m)

実施例 2 5

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 1 で得られた 2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (65g) 及び 3-クロロフェニルボロン酸 (23g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (59g, 収率85%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.51(1H, d, J=1.8Hz), 7.99(1H, dd, J=8.7, 1.8Hz), 7.71-7.55(4H, m), 7.51-7.43(2H, m), 7.43-7.27(4H, m), 7.19(1H, d, J=8.4Hz), 7.12(1H, m), 4.41(2H, q, J=7.2Hz), 4.39(1H, m), 2.42-2.22(2H, m), 2.03-1.87(4H, m), 1.79(1H, m), 1.42(3H, t, J=7.2Hz), 1.39-1.29(3H, m)

実施例 2 6

2- {4- [3- (3-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 2 5 で得られた 2- {4- [3- (3-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (59g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (43g, 収率76%) を得た。

融点: 253-254°C

FAB-MS: 523(MH⁺)

¹H-NMR (300MHz, DMSO-d₆): 12.82 (1H, brs), 8.24 (1H, d, J=1.3Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.89 (1H, dd, J=8.7, 1.3Hz), 7.78 (1H, s), 7.72 (2H, d, J=9.7Hz), 7.70 (1H, m), 7.64-7.42 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 7.20 (1H, m), 4.33 (1H, m), 2.39-2.17 (2H, m), 2.00-1.76 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.50-1.22 (3H, m)

実施例 2 7

2- [4- (3-アセトキシフェニルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 1 と同様にして表題化合物 (87g) を得た。

実施例 2 8

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-ヒドロキシフェニルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 2 7 で得られた 2- [4- (3-アセトキシフェニルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (87g) をメチルアルコール (250ml)、テトラヒドロフラン (250ml) に溶解し、炭酸カリウム (31g) を加え、室温にて30分攪拌した。不溶物をろ別し、ろ液を減圧濃縮した。残渣に水を加え、2N塩酸で中和し、析出した結晶を濾取して表題化合物 (78g, 収率97%) を得た。

¹H-NMR (300MHz, DMSO-d₆): 9.71 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.68 (2H, d, J=8.6Hz), 7.24 (1H, t, J=8.1Hz), 7.18 (2H, d, J=8.6Hz), 6.63 (1H, d, J=8.1Hz), 6.57 (1H, d, J=8.1Hz), 6.51 (1H, s), 4.38-4.23 (1H, m), 4.35 (2H, q, J=6.9Hz),

2.36-2.18(2H,m), 1.99-1.78(4H,m), 1.71-1.59(1H,m), 1.45-1.20(3H,m), 1.36(3H, t, J=6.9Hz)

実施例 29

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-ピリジルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 28 で得られた 1-シクロヘキシル-2- [4- (3-ヒドロキシフェニルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (78g) をジメチルホルムアミド (800ml) に懸濁し、氷冷下、水素化ナトリウム (60%油性、14g) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を氷冷し、4-クロロメチルピリジン塩酸塩 (29g) を加え30分攪拌した後、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、析出した結晶を濾取した。これをエチルアルコールより再結晶して、表題化合物 (77g, 収率82%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.63(2H, d, J=6.0Hz), 8.51(1H, s), 7.99(1H, d, J=8.7Hz), 7.66(2H, d, J=8.7Hz), 7.62(2H, d, J=8.7Hz), 7.36(2H, d, J=8.7Hz), 7.31(1H, t, J=8.2Hz), 7.26(1H, s), 7.16(2H, d, J=8.7Hz), 6.79-6.70(3H, m), 5.09(2H, s), 4.47-4.31(1H, m), 4.42(2H, q, J=7.0Hz), 2.42-2.22(2H, m), 2.04-1.71(5H, m), 1.45-1.25(3H, m), 1.42(3H, t, J=7.0Hz)

実施例 30

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-ピリジルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 29 で得られた 1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-ピリジルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (60g) を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物 (54g、収率75%) を得た。

融点: 235-237°C

FAB-MS: 520(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆): 8.58(2H, d, J=6.0Hz), 8.23(1H, s), 7.96 and 7.86(2H, AB q, J=8.7Hz), 7.68 and 7.17(4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.44(2H, d, J=8.7Hz), 7.39(1H, t, J=8.3Hz), 6.90(1H, d, J=8.1Hz), 6.84(1H, s), 6.75(1H, d, J=8.1Hz), 5.22(2H, s), 4.40-

4.22(1H,m),2.40-2.19(2H,m),2.00-1.80(4H,m)

実施例 2 4 1

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

工程 1 : 2-ブロモ-5-メトキシベンズアルデヒドの製造

3-メトキシベンズアルデヒド (15g) を酢酸 (75ml) に溶解し、酢酸 (15ml) に溶解した臭素 (5.7ml) を滴下し、室温で終夜攪拌した。反応液に水 (150ml) を加え、析出した結晶を濾取、水洗、減圧乾燥し、表題化合物 (21g, 収率88%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 10.31(1H, s), 7.52(1H, d, J=8.8Hz), 7.41(1H, d, J=3.3Hz), 7.03(1H, dd, J=8.8, 3.3Hz), 3.48(3H, s)

工程 2 : 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンズアルデヒドの製造

前工程で得られた 2-ブロモ-5-メトキシベンズアルデヒド (10g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (11g, 収率96%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 9.92(1H, s), 7.50(1H, d, J=2.6Hz), 7.48-7.14(6H, m), 3.90(3H, s)

工程 3 : 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルアルコールの製造

前工程で得られた 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンズアルデヒド (10g) をテトラヒドロフラン (30ml) に溶解し、これを水素化ホウ素ナトリウム (620mg) をイソプロピルアルコール (50ml) に懸濁したものに滴下し、1時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、残渣に水を加え析出した結晶を濾取して減圧乾燥した。これを、メタノールと水の混合液より再結晶して表題化合物 (9.2g, 収率91%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 7.37(2H, d, J=8.6Hz), 7.27(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(1H, d, J=8.6Hz), 7.11(1H, d, J=2.6Hz), 6.89(1H, dd, J=8.6, 2.6Hz), 4.57(2H, s), 3.86(3H, s)

工程 4 : 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルクロリドの製造
前工程で得られた 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルアルコ

ール (20g) を酢酸エチル (100ml)、ピリジン (0.5ml) に溶解し、塩化チオニル (11ml) を滴下し1時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水、水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣にイソプロピルアルコールを加え結晶化し、これを濾取、減圧乾燥し、表題化合物 (16g, 収率74%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDC13): 7.43-7.29(4H, m), 7.17(1H, d, J=8.6Hz), 7.05(1H, d, J=2.6Hz), 6.96-6.89(1H, m), 4.46(2H, s), 3.86(3H, s)

工程5: 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルクロリド (4.0g)、実施例3と同様にして得られた 1-シクロヘキシル-2- (4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (5.0g) を用い実施例4と同様の方法により、表題化合物 (6.0g, 収率72%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDC13): 8.48(1H, s), 8.00-7.93(1H, m), 7.68-7.62(1H, m), 7.54(2H, d, J=9.0Hz), 7.41-7.16(6H, m), 7.04-6.93(3H, m), 4.97(2H, s), 4.36(1H, m), 3.94(3H, s), 3.87(3H, s), 2.39-2.21(2H, m), 2.02-1.88(4H, m), 1.85-1.45(4H, m)

実施例 2 4 2

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩の製造

実施例241で得られた 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (5.0g) を用い、実施例2と同様の方法により、表題化合物 (5.1g, 収率98%) を得た。

APCI-Ms: 568(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆): 8.30(1H, d, J=1.4Hz), 8.24(1H, d, J=8.7Hz), 8.03(1H, d, J=8.7Hz), 7.72(2H, d, J=8.7Hz), 7.51-7.39(4H, m), 7.34-7.18(4H, m), 7.11-7.03(1H, m), 5.08(2H, s), 4.35(1H, m), 3.83(3H, m), 2.40-2.18(2H, m), 2.10-1.96(2H, m), 1.93

-1.78(2H,m), 1.72-1.18(4H,m)

実施例 2 4 3

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1 : 3-ヒドロキシピコリン酸メチルエステルの製造

3-ヒドロキシピコリン酸 (1.0g) をメタノール (10ml) に懸濁し、濃硫酸 (1.0ml) を加え、5時間加熱還流した。反応液を氷冷し、飽和重曹水を加え中和した後、クロロホルムで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (711mg, 収率64%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 10.63(1H, s), 8.28(1H, dd, J=3.7, 1.8Hz), 7.47-7.35(2H, m), 4.06(3H, s)

工程 2 : 3- (トリフルオロメチルスルホニルオキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 3-ヒドロキシピコリン酸メチルエステル (710mg)、トリエチルアミン (0.77ml) をジクロロメタン (7ml) に溶解し、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.86ml) を加えた。反応液を室温に戻し、2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (1.2g, 収率90%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.80-8.73(1H, m), 7.75-7.70(1H, m), 7.63(1H, dd, J=8.2, 4.5Hz), 4.05(3H, s)

工程 3 : 3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 3- (トリフルオロメチルスルホニルオキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステル (1.2g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (728mg, 収率69%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.73-8.66(1H, m), 7.77-7.68(1H, m), 7.49(1H, dd, J=7.8,

4.5Hz), 7.46-7.37(2H, m), 7.32-7.23(2H, m), 3.80(3H, s)

工程 4 : [3 - (4 - クロロフェニル) ピリジン - 2 - イル] メタノールの製造

前工程で得られた 3 - (4 - クロロフェニル) ピリジン - 2 - カルボン酸メチルエステル (720mg) をテトラヒドロフラン (10ml) に溶解し氷冷した。これに水素化リチウムアルミニウム (160mg) を加え、1時間攪拌した。反応液に、水 (1.6ml) 、15%水酸化ナトリウム (1.6ml) 、水 (4.8ml) を順次加え、不溶物をろ別して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) で精製して、表題化合物 (208mg, 収率32%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.60(1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 7.60-7.55(1H, m), 7.40-7.48(2H, m), 7.29-7.36(1H, m), 7.27-7.20(3H, m), 4.63(2H, s)

工程 5 : 2 - { 4 - [3 - (4 - クロロフェニル) ピリジン - 2 - イルメトキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた [3 - (4 - クロロフェニル) ピリジン - 2 - イル] メタノール (200mg) をクロロホルム (3ml) に溶解し、塩化チオニル (0.13ml) 、ピリジン (触媒量) を加え、室温で1時間攪拌し、減圧濃縮した。残渣をジメチルホルムアミド (3ml) に溶解し、実施例 3 と同様にして得られた 1 - シクロヘキシル - 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル (232mg) 、炭酸カリウム (250mg) を加え、80°Cで3時間攪拌した。反応液を放冷し、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) で精製し、表題化合物 (246mg, 収率68%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.71(1H, dd, J=4.7, 1.4Hz), 8.49(1H, d, J=2.1Hz), 7.96(1H, d, J=10.2Hz), 7.71-7.62(2H, m), 7.53(2H, d, J=8.7Hz), 7.45-7.34(5H, m), 7.04(2H, d, J=8.7Hz), 5.14(2H, s), 4.48-4.29(3H, m), 2.38-2.19(2H, m), 2.02-1.22(11H, m)

実施例 2 4 4

2-[4-(2-ブromo-5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

工程1: 4-ブromo-3-メチル安息香酸-tert-ブチルエステルの製造

4-ブromo-3-メチル安息香酸 (25g) をジクロロメタン (200ml) に懸濁し、塩化オキサリル (12ml)、ジメチルホルムアミド (触媒量) を加え、室温で2時間攪拌した。溶媒を減圧留去して残渣をテトラヒドロフラン (200ml) に溶解し氷冷した。これに、テトラヒドロフラン (150ml) に溶解したカリウム-tert-ブトキシドを滴下し、30分間攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウム乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (27g, 収率85%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 7.83(1H, d, J=2.2Hz), 7.67-7.53(2H, m), 2.43(3H, s), 1.58(9H, s)

工程2: 2-[4-(2-ブromo-5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた4-ブromo-3-メチル安息香酸-tert-ブチルエステル (7.0g) 及び実施例3と同様にして得られた1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (6.3g) を用い、実施例4と同様の方法により、表題化合物 (8.8g, 収率77%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.49(1H, d, J=1.5Hz), 8.21(1H, d, J=2.1Hz), 7.97(1H, d, J=10.2Hz), 7.82(1H, d, J=10.2Hz), 7.71-7.58(4H, m), 7.16(2H, d, J=8.7Hz), 5.23(2H, s), 4.38(1H, m), 3.95(3H, s), 2.40-2.23(2H, m), 2.04-1.90(4H, m), 1.84-1.73(1H, m), 1.59(9H, s), 1.44-1.27(3H, m)

実施例245

2-{4-[5-tert-ブトキシカルボニル-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例244で得られた2-[4-(2-ブromo-5-tert-ブトキシカ

ルボニルベンジルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (4.5g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (3.6g, 収率76%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.48(1H, s), 8.27(1H, d, J=1.8Hz), 8.04(1H, dd, J=7.9, 1.5Hz), 7.96(1H, dd, J=7.0, 1.5Hz), 7.65(1H, d, J=8.6Hz), 7.55(2H, d, J=8.6Hz), 7.43-7.32(5H, m), 7.01(2H, d, J=8.6Hz), 4.99(2H, s), 4.43-4.29(1H, m), 3.95(3H, s), 2.41-2.21(2H, m), 2.02-1.89(4H, m), 1.82-1.73(1H, m), 1.62(9H, s), 1.46-1.28(3H, m)

実施例 2 4 6

2 - { 4 - [5 - カルボキシ - 2 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル 塩酸塩の製造

実施例 2 4 5 で得られた 2 - { 4 - [5 - tert - ブトキシカルボニル - 2 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (3.5g) をジクロロメタン (35ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (35ml) を加え室温で1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解して、4 N塩酸 - 酢酸エチルを加え、析出した結晶を濾取、減圧乾燥して表題化合物 (3.3g, 収率97%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆): 8.33(1H, d, J=1.5Hz), 8.29(1H, s), 8.24(1H, d, J=1.8Hz), 8.09-8.00(2H, m), 7.74(2H, d, J=8.6Hz), 7.61-7.44(5H, m), 7.24(2H, d, J=8.6Hz), 5.19(2H, s), 4.36(1H, m), 3.93(3H, s), 2.37-1.21(10H, m)

実施例 2 4 7

2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 2 4 6 で得られた 2 - { 4 - [5 - カルボキシ - 2 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル 塩酸塩 (400mg) をジクロロメタン (5ml) に懸濁し、塩化オキサリル (0.08ml)、ジメチルホルムアミド (触媒量) を加え室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をジクロロメタン (5ml) に溶解し

た。これを、40%メチルアミン水溶液 (5ml)、テトラヒドロフラン (5ml) の混合溶液に、氷冷下滴下した。反応液を1時間攪拌し、減圧濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチル、ジイソプロピルエーテルで結晶化した。これを濾取、減圧乾燥して表題化合物 (335mg, 収率86%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.47(1H, s), 8.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.96(1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.82(1H, dd, J=8.2, 2.2Hz), 7.64(1H, d, J=8.6Hz), 7.54(2H, d, J=9.0Hz), 7.44-7.31(5H, m), 6.99(2H, d, J=9.0Hz), 6.35-6.26(1H, m), 5.00(2H, s), 4.35(1H, m), 3.95(3H, s), 3.05(3H, d, J=4.8Hz), 2.40-1.24(10H, m)

実施例 2 4 8

2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸塩酸塩の製造

実施例 2 4 7 で得られた 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (150mg)、テトラヒドロフラン (2ml) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (141mg, 収率90%) を得た。

APCI-MS: 594(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆): 8.65-8.58(1H, m), 8.27(1H, d, J=1.5Hz), 8.21(1H, d, J=8.2Hz), 8.15(1H, d, J=1.5Hz), 8.05-7.90(2H, m), 7.70(2H, d, J=8.6Hz), 7.56-7.43(5H, m), 7.21(2H, d, J=8.6Hz), 5.14(2H, s), 4.34(1H, m), 2.81(3H, d, J=4.5Hz), 2.39-1.19(10H, m)

実施例 1 から 3 0 及び実施例 2 4 1 から 2 4 8 と同様な方法により、また必要に応じその他常法を用いることにより、実施例 3 1 から 2 4 0、実施例 2 4 9 から 3 2 7、7 0 1、及び 1 0 0 1 から 1 5 5 9 を得た。化学構造式及び物性値を表 1 乃至 1 7 7、及び 1 8 5 乃至 2 1 2 に示す。

実施例 5 0 1

2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フ

エニル} - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

工程 1 : 3 - ブロモ - 4 - シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステルの製造

3 - ブロモ - 4 - フルオロ安息香酸 (2.0g) をメタノール (20ml) に溶解し、濃硫酸 (2ml) を加え、3時間還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去した。残渣をジメチルスルホキシド (20ml) に溶解し、シクロヘキシルアミン (10.3ml) を加え、120°Cで終夜攪拌した。反応液を10%クエン酸水溶液 (100ml) に注ぎ、酢酸エチル (100ml) で抽出した。有機層を水 (50ml)、飽和食塩水 (50ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 10 : 1) で精製し、表題化合物 (2.6g, 収率92%)を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 8.10(1H, d, J=1.9Hz), 7.83(1H, dd, J=1.9Hz, 8.6Hz), 6.59(1H, d, J=8.7Hz), 4.73(1H, brd, J=7.3Hz), 3.85(3H, s), 3.38(1H, m), 2.10-2.00(2H, m), 1.90-1.20(8H, m)

工程 2 : 4' - クロロ - 2 - (4 - ヨードフェノキシメチル) - 4 - メトキシビフェニルの製造

4 - ヨードフェノール (5.0g) をアセトン (50ml) に溶解し、炭酸カリウム (4.7g)、実施例 2 4 1 の第 4 工程で得られた 4' - クロロ - 2 - クロロメチル - 4 - メトキシビフェニル (6.0g) を加え、10時間還流した。反応液を濃縮し、4 N 水酸化ナトリウム水溶液 (50ml) を加えた。析出した結晶を濾取、水洗、減圧乾燥し、表題化合物 (10.0g, 収率98%)を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 7.52(2H, d, J=8.9Hz), 7.35(2H, d, J=8.5Hz), 7.27-7.20(3H, m), 7.12(1H, s), 6.95(1H, d, J=8.5Hz), 6.62(2H, d, J=8.9Hz), 4.84(2H, s), 3.85(3H, s)

工程 3 : [4 - (4' - クロロ - 4 - メトキシビフェニル - 2 - イルメトキシ)フェニルエチニル] トリメチルシランの製造

前工程で得られた 4' - クロロ - 2 - (4 - ヨードフェノキシメチル) - 4 -

メトキシビフェニル (7.0g) をアセトニトリル (50ml) に溶解し、トリメチルシリルアセチレン (2.3g)、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム錯体 (1.8g)、ヨウ化銅 (I) (0.6g)、トリエチルアミン (50ml) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を濃縮し、水 (30ml) を加え、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 10 : 1) で精製し、表題化合物 (5.1g, 収率79%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 7.37(2H, d, J=8.9Hz), 7.34(2H, d, J=8.2Hz), 7.28-7.21(3H, m), 7.13(1H, s), 6.94(1H, d, J=8.2Hz), 6.75(2H, d, J=8.9Hz), 4.87(2H, s), 3.85(3H, s), 0.23(9H, s)

工程4: 3-[4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステルの製造

前工程で得られた [4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]トリメチルシラン (5.1g) をメタノール (50ml)、クロロホルム (50ml) に溶解し、炭酸カリウム (2.5g) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を濃縮し、水 (30ml) を加え、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去し白色結晶 (3.8g) を得た。この白色結晶 (2.3g) をアセトニトリル (10ml) に溶解し、工程1で得られた3-ブromo-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステル (1.0g)、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム錯体 (0.4g)、ヨウ化銅 (I) (0.1g)、トリエチルアミン (10ml) を加え、100°Cで終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮し、水 (30ml) を加え、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 8 : 1) で精製し、表題化合物 (0.9g, 収率49%) を得た。

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃): 8.03(1H, s), 7.84(1H, d, J=8.7Hz), 7.42-7.22(7H, m), 7.1

5(1H, s), 6.95(1H, d, J=8.2Hz), 6.85(2H, d, J=8.8Hz), 6.59(1H, d, J=8.8Hz), 5.07(1H, brs), 4.91(2H, s), 3.86(3H, s), 3.85(3H, s), 3.42(1H, m), 2.15-2.00(2H, m), 1.80-1.20(8H, m)

工程 5 : 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 3 - [4 - (4' - クロロ - 4 - メトキシビフェニル - 2 - イルメトキシ) フェニルエチニル] - 4 - シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステル (0.5g) を N, N - ジメチルホルムアミド (5ml) に溶解し、ヨウ化銅 (I) (0.17g) を加え、180°C で 3 時間還流した。反応液をろ過することにより不溶物を除いた後、水 (10ml) を加え、酢酸エチル (30ml) で抽出した。有機層を水 (10ml)、飽和食塩水 (10ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 8 : 1) で精製し、表題化合物 (0.27g, 収率 55%) を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 8.34(1H, s), 7.85(1H, d, J=8.8Hz), 7.62(1H, d, J=8.8Hz), 7.40-7.18(8H, m), 7.00-6.94(3H, m), 6.48(1H, s), 4.95(2H, m), 4.18(1H, m), 3.93(3H, s), 3.88(3H, s), 2.45-2.25(2H, m), 1.95-1.20(8H, m)

実施例 5 0 2

2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸の製造

実施例 5 0 1 で得られた 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸メチルエステル (0.27g) を用い、実施例 2 と同様な方法により、表題化合物 (0.19g, 収率 71%) を得た。

APCI-Ms: 566(MH⁺)

¹H-NMR (300MHz, DMSO-d₆): 12.43(1H, brs), 8.20(1H, s), 7.79(1H, d, J=9.3Hz), 7.72(1H, d, J=9.0Hz), 7.50-7.20(8H, m), 7.07-7.03(3H, m), 6.53(1H, s), 5.01(2H, s), 4.13(1H, m), 3.83(3H, m), 2.35-2.25(2H, m), 1.85-1.10(8H, m)

実施例 5 0 1 及び 5 0 2 と同様な方法により、また必要に応じてその他常法を

用いることにより、実施例 503 を得た。化学構造式及び物性値を表 207 に示す。

実施例 601

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1: 4-ベンジルオキシ-N-メトキシ-N-メチルベンズアミドの製造
4-ベンジルオキシ安息香酸 (5.0g)、N,0-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (2.5g) をジメチルホルムアミド (50ml) に懸濁し、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (5.0g)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (3.5g)、トリエチルアミン (3.6ml) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和重曹水、水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (5.6g, 収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 7.22(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.28-7.46(5H, m), 6.97(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 5.10(2H, s), 3.56(3H, s), 3.35(3H, s)

工程 2: 1-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-シクロヘキシルエタノールの製造

マグネシウム (470mg) をテトラヒドロフラン (2ml) に懸濁し、シクロヘキシルメチルプロミド (3.4g) を室温で滴下した。滴下後、反応液を 60°C で 30 分攪拌した。反応液を放冷し、テトラヒドロフラン (5ml) で希釈した。前工程で得られた 4-ベンジルオキシ-N-メトキシ-N-メチルベンズアミド (3.4g) をテトラヒドロフラン (10ml) に溶解し、室温で反応液に滴下し、2 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン: 酢酸エチル = 9 : 1) で精製し、表題化合物 (3.8g, 収率66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): 7.93(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.28-7.46(5H, m), 7.00(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 5.13(2H, s), 2.76(2H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.95(1H, m), 0.78-1.82(10H, m)

工程 3: 1-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-ブロモ-2-シクロヘキ

シルエタノンの製造

前工程で得られた 1-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-シクロヘキシルエタノン (1.0g) を 1,4-ジオキサン (10ml) に溶解して、臭素 (0.17ml) を加え室温で10分間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 9 : 1) で精製し、表題化合物 (696mg, 収率55%) を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃): 7.98(2H, d, J=8.9Hz), 7.28-7.48(5H, m), 7.02(2H, d, J=8.9Hz), 5.14(2H, s), 4.89(1H, d, J=9.3Hz), 0.86-3.30(11H, m)

工程 4 : 2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステルの製造

公知の方法 (特開平08-048651号) により製造した 2-アミノピリジン-4-カルボン酸エチルエステル (214mg)、前工程で得られた 1-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-ブロモ-2-シクロヘキシルエタノン (500mg)、炭酸カリウム (356mg) を 140°C で 5 時間攪拌した。反応液を放冷し、クロロホルムを加え不溶物をろ別し減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) で精製し、表題化合物 (95mg, 収率16%) を得た。

APCI-MS : 455(MH⁺)

¹H-NMR: (300MHz, CDCl₃): 8.33(1H, s), 8.21(1H, d, J=7.5Hz), 7.55(2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.50(6H, m), 5.13(2H, s), 4.41(2H, q, J=7.1Hz), 3.25(1H, m), 1.41(3H, t, J=7.1Hz), 1.15-2.00(10H, m)

実施例 602

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸の製造

前工程で得られた 2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル (95mg) を用い、実施例 2 と同様な方法により、表題化合物 (33mg, 37%) を得た。

APCI-MS : 427(MH⁺)

¹H-NMR(300MHz,DMSO-d₆):8.67(1H,d,J=7.3Hz),8.08(1H,s),7.25-7.58(8H,m),7.13(2H,d,J=8.7Hz),5.17(2H,s),3.23(1H,m),1.25-2.10(10H,m)

実施例 1 から 701 と同様な方法により、また必要に応じその他常法を用いることにより、更に表 213 乃至 218 に示される化合物を得ることが出来る。

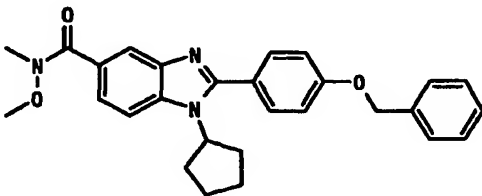
表 1

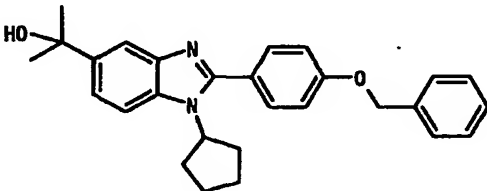
| | | |
|-------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 31 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, CDC13 7.81 (2H, d, J=6.6Hz), 7.60 (2H, d, J=8.8Hz), 7.51-7.21 (8H, m), 7.11 (2H, d, J=8.8Hz), 5.15 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.36-2.32 (2H, m), 2.09-2.04 (3H, m), 1.75-1.68 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 369 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 32 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, CDC13 8.51 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, d, J=8.4Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56-7.10 (6H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=9.3Hz), 4.41 (2H, q, J=7.5Hz), 2.40-1.50 (8H, m), 1.41 (3H, t, J=7.5Hz) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 441 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 33 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, CDC13 7.84 (1H, s), 7.61 (2H, d, J=9.0Hz), 7.58-7.30 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=9.0Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.10 (6H, brs), 2.40-1.50 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 440 (M+1) | |

表 2

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 34 | 1H NMR(δ) ppm 300MHz, CDC13 8.20(1H, s), 7.50-7.31(9H, m), 7.12(2H, d, J=8.7Hz), 5.15(2H, s), 4.94(1H, quint, J=8.7Hz), 3.61(3H, s), 3.40(3H, s), 2.41-1.42(8H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 456 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 35 | 1H NMR(δ) ppm 300MHz, CDC13 7.91(1H, s), 7.59(2H, d, J=8.7Hz), 7.49-7.30(7H, m), 7.11(2H, d, J=8.8Hz), 5.15(2H, s), 4.19(1H, quint, J=8.8Hz), 2.41-2.22(2H, m), 2.13-1.49(14H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 427 (M+1) | |

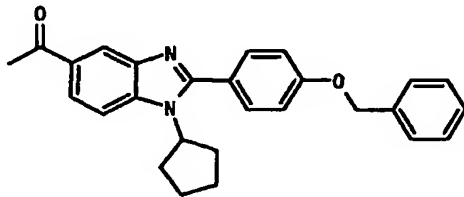
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 36 | 1H NMR(δ) ppm 300MHz, CDC13 8.40(1H, d, J=1.4Hz), 7.95(1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.61(2H, d, J=8.7Hz), 7.57-7.30(6H, m), 7.13(2H, d, J=8.7Hz), 5.16(2H, s), 4.95(1H, quint, J=8.8Hz), 2.64(3H, s), 2.40-1.54(8H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 411 (M+1) | |

表 3

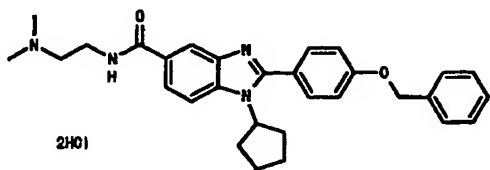
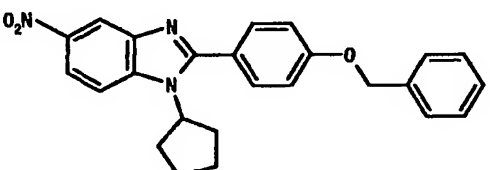
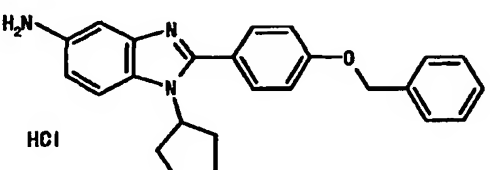
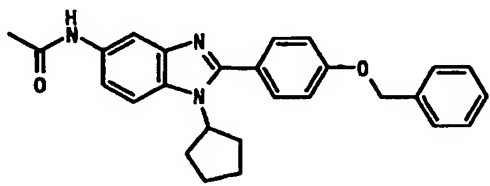
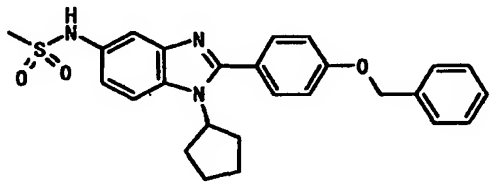
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 37 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 10.47 (1H, brs,), 9.15 (1H, brs), 8.40 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.55-7.29 (7H, m), 5.26 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.77-3.63 (2H, m), 3.39-3.23 (2H, m), 2.84 (6H, d, J=4.8Hz), 2.32-1.60 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 483 (M+1) | |
| 実施例番号 | 38 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDCl3 8.69 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=9.0Hz), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54 (1H, d, J=9.0Hz), 7.48-7.36 (5H, m), 7.15 (2H, d, J=8.7Hz), 5.17 (2H, s), 4.98 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.27-2.07 (6H, m), 1.82-1.78 (2H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 414 (M+1) | |
| 実施例番号 | 39 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 7.84 (1H, d, J=9.0Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.33 (8H, m), 7.26 (1H, d, J=9.0Hz), 5.27 (2H, s), 4.92 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.19-1.70 (8H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 384 (M+1) | |

表 4

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 40 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDCl ₃ 7.72 (1H, s), 7.60-7.35 (10H, m), 7.10 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.90 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.29-2.19 (2H, m), 2.19 (3H, s), 2.19-1.74 (6H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 426 (M+) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 41 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDCl ₃ 7.66 (1H, s), 7.61 (2H, d, J=8.8Hz), 7.50-7.28 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=8.8Hz), 6.86 (1H, brs), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.97 (3H, s), 2.29-1.76 (8H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 462 (M+) | |

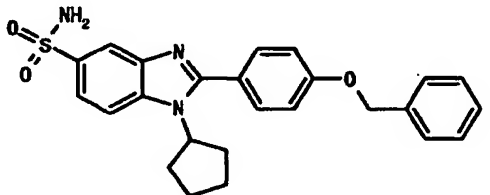
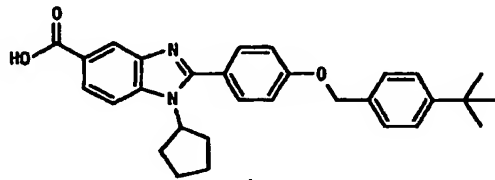
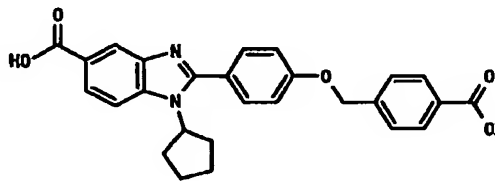
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 42 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO 8.11 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.51 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.37 (1H, m), 7.29 (2H, s), 7.23 (2H, d, J=8.4Hz), 5.22 (2H, s), 4.89 (1H, quintet, J=9.2Hz), 2.2-2.0 (6H, m), 1.7 (2H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 448 (M+) | |

表 5

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 43 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=9.0Hz), 7.99 (1H, d, J=9.0Hz), 7.47-7.41 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.4Hz), 5.22 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.25-1.60 (8H, m), 1.30 (9H, s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 469 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 44 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.9 (2H, brs), 8.25 (1H, s), 8.00 (2H, d, J=7.8Hz), 7.90 (1H, d, J=8.4Hz), 7.74 (1H, d, J=8.7Hz), 7.67 (2H, d, J=9.0Hz), 7.62 (2H, d, J=8.1Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 5.32 (2H, s), 4.88 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.25-1.60 (8H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 457 (M+1) | |

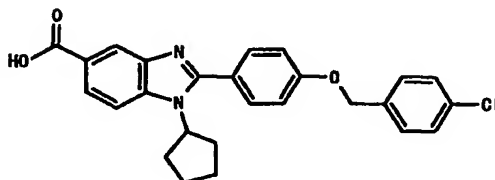
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 45 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.4 (1H, brs), 8.32 (1H, s), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (2H, d, J=8.8Hz), 7.56-7.48 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.8Hz), 5.27 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.9Hz), 2.30-1.60 (8H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 447 (M+1) | |

表 6

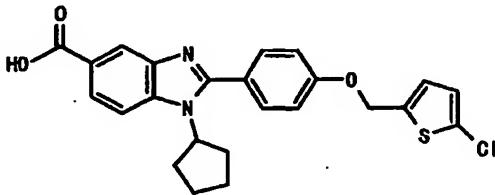
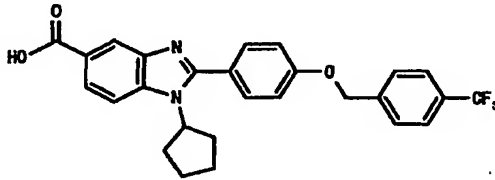
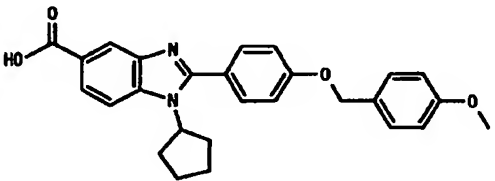
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 46 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.7Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.4Hz), 7.34 (2H, d, J=8.4Hz), 7.19 (1H, d, J=3.6Hz), 7.09 (1H, d, J=3.6Hz), 5.41 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.30-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 453 (M+1) | |
| 実施例番号 | 47 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.4Hz), 7.98 (1H, d, J=9.0Hz), 7.82-7.72 (6H, m), 7.35 (2H, d, J=9.0Hz), 5.40 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.35-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 481 (M+1) | |
| 実施例番号 | 48 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.70 (1H, d, J=8.4Hz), 7.64 (2H, d, J=8.4Hz), 7.43 (2H, d, J=8.4Hz), 7.20 (2H, d, J=8.4Hz), 6.98 (2H, d, J=8.4Hz), 5.13 (2H, s), 4.88 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.77 (3H, s), 2.35-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 443 (M+1) | |

表 7

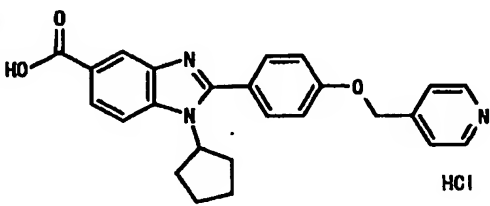
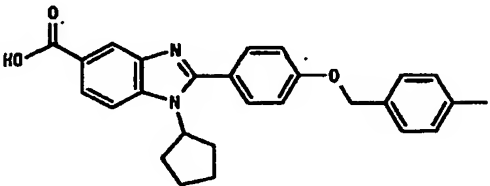
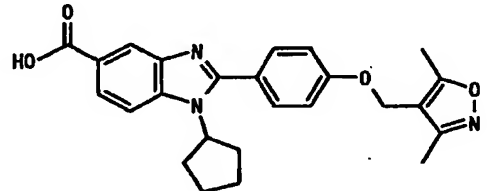
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 49 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.6Hz), 8.35 (1H, s), 8.06-8.04 (3H, m), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.83 (2H, d, J=8.7Hz), 7.38 (2H, d, J=8.7Hz), 5.61 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.40-1.60 (8H, m). |
|  | | HCl |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 414 (M+1) | |
| 実施例番号 | 50 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99 (1H, d, J=9.0Hz), 7.78 (2H, d, J=8.4Hz), 7.39 (2H, d, J=8.1Hz), 7.32 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (2H, d, J=7.8Hz), 5.22 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.32 (3H, s), 2.30-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 427 (M+1) | |
| 実施例番号 | 51 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=9.0Hz), 7.77 (2H, d, J=8.4Hz), 7.31 (2H, d, J=8.7Hz), 5.07 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.45 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.26-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 432 (M+1) | |

表 8

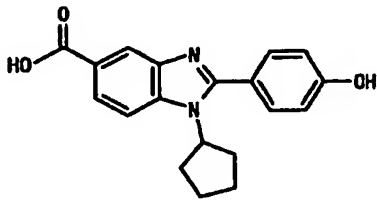
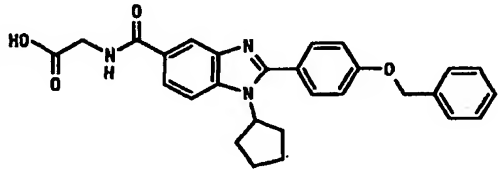
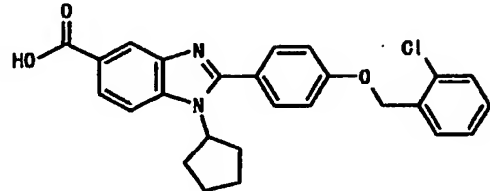
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 52 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 10.0 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.69 (1H, d, J=8.6Hz), 7.53 (2H, d, J=8.6Hz), 6.96 (2H, d, J=8.6Hz), 4.89 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.30-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 323 (M+1) | |
| 実施例番号 | 53 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 9.18 (1H, t, J=5.6Hz), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=9.6Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.32 (7H, m), 5.27 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.99 (2H, d, J=5.7Hz), 2.40-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 470 (M+1) | |
| 実施例番号 | 54 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.4Hz), 7.67 (1H, t, J=4.5Hz), 7.56 (1H, t, J=4.5Hz), 7.45-7.42 (2H, m), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 5.31 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.30-1.60 (8H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 447 (M+1) | |

表 9

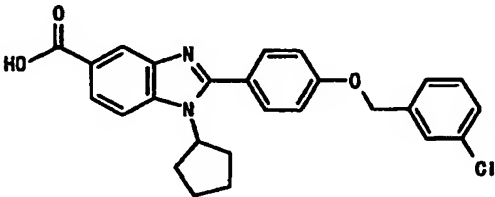
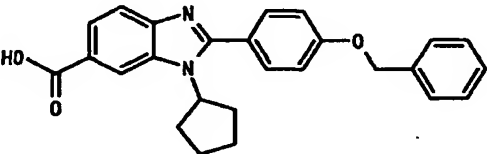
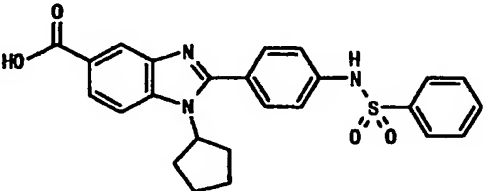
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 55 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 12.78 (1H, br s), 8.24 (1H, s), 7.88 and 7.72 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.66 and 7.23 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.58 (1H, s), 7.48-7.42 (3H, m), 5.24 (1H, s), 4.88 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.30-1.91 (6H, m), 1.78-1.60 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 447 (M+1) | |
| 実施例番号 | 56 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO 12.89 (1H, broad), 8.18 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.4Hz), 7.74 (1H, d, J=9.2Hz), 7.67 (2H, d, J=8.8Hz), 7.52 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.38 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 5.22 (2H, s), 4.94 (1H, quintet, J=8.9Hz), 2.16 (4H, m), 1.98 (2H, m), 1.73 (2H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 413 (M+) | |
| 実施例番号 | 57 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 10.99 (1H, s), 8.26 (1H, s), 8.01-7.86 (4H, m), 7.69-7.59 (5H, m), 7.38 (2H, d, J=8.7Hz), 4.86 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.12-1.90 (6H, m), 1.72-1.59 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 462 (M+1) | |

表 10

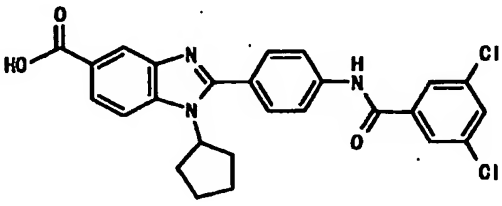
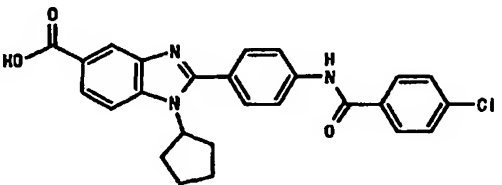
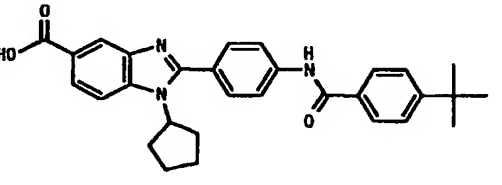
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 58 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.78 (1H, s), 10.69 (1H, s), 8.26-7.72 (9H, m), 4.92 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.34-1.70 (6H, m), 1.75-1.61 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 494 (M+1) | |
| 実施例番号 | 59 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.82 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8 .14 and 7.84 (4H, ABq, J=8.4H z), 8.06 and 7.66 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 8.06-7.98 (4H, m), 5.01 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.35-2.15 (4H, m), 2.11-1.9 6 (2H, m), 1.80-1.62 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 460 (M+1) | |
| 実施例番号 | 60 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.61 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8 .12 and 7.81 (4H, ABq, J=8.9H z), 8.03 and 7.93 (2H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.95 and 7.59 (4H, A'' B'' q, J=8.4Hz), 4.99 (1H, q uint, J=9.0Hz), 2.33-2.12 (4H, m), 2.10-1.93 (2H, m), 1. 80-1.63 (2H, m), 1.34 (9H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 482 (M+1) | |

表 11

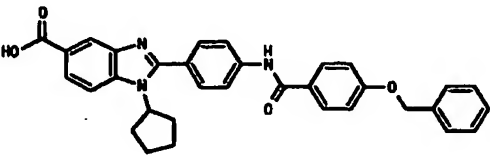
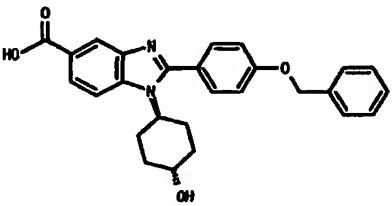
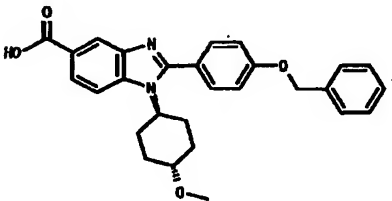
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 61 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 10.6 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.13 (2H, d, J=8.7Hz), 8.09-7.98 (4H, m), 7.82 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.35 (5H, m), 7.20-7.17 (2H, d, J=9.0Hz), 5.24 (2H, s), 5.01 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.40-1.60 (8H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 532 (M+1) | |
| 実施例番号 | 62 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (2H, d, J=6.9Hz), 7.46-7.39 (5H, m), 5.28 (2H, s), 4.38 (1H, m), 3.71 (1H, m), 2.60-2.15 (2H, m), 2.04-1.96 (4H, m), 1.30-1.20 (2H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 443 (m+1) | |
| 実施例番号 | 63 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.71 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51 (2H, d, J=6.9Hz), 7.46-7.37 (3H, m), 7.30 (2H, d, J=8.4Hz), 5.25 (3H, s), 4.39 (1H, m), 3.44 (1H, m), 3.27 (3H, s), 2.60-1.95 (6H, m), 1.25-1.05 (2H, m). |
| 純度 | 約 90 % (NMR) | |
| MS | 457 (M+1) | |

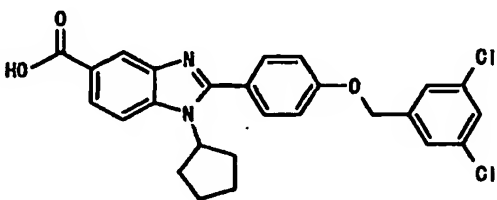
表 12

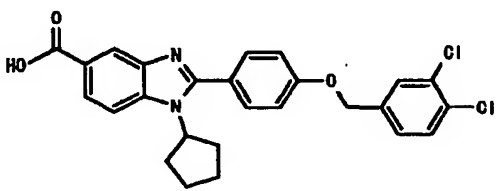
| | | |
|-------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 64 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.25 (1H, brs), 7.70-7.30 (9H, m), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 7.14 (1H, d, J=8.4Hz), 5.20 (2H, s), 4.84 (1H, quint, J=6.0Hz), 3.66 (2H, s), 2.30-1.51 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 427 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 65 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.64 (1H, brs), 8.13 (1H, s), 7.80 (1H, d, J=7.2Hz), 7.59 (1H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.30 (5H, m), 5.11 (2H, s), 5.03 (1H, quint, J=8.7Hz), 4.20-4.05 (2H, m), 3.45-3.90 (3H, m), 2.15-1.60 (12H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 448 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 66 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.59 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.10 (2H, d, J=8.6Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 8.00-7.85 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=8.6Hz), 7.41 (2H, d, J=8.2Hz), 4.98 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.71-1.10 (19H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 508 (M+1) | |

表 13

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 67 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.81 (1H, brs), 8.42 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.5Hz), 7.80 -7.52 (6H, m), 7.44 (2H, d, J= 8.6Hz), 5.25 (2H, s), 4.88 (1 H, quint, J=8.8Hz), 2.30-1. 52 (8H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 481 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 68 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.4Hz), 8.05 (1H, d, J=8.6Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 8.86-8.61 (4H, m), 7.51 (1H, d, J=6.3Hz), 7.33 (2H, d, J=8.8Hz), 5.28 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.31-1.60 (8H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 481 (M+1) | |

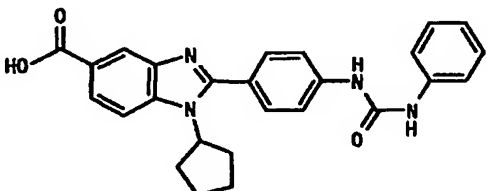
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 69 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 9.88 (1H, s), 9.42 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.09 and 8.02 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.81 and 7.78 (4H, A'B'q, J=9.2Hz), 7.50 (2H, d, J=7.8Hz), 7.31 (2H, t, J=7.8Hz), 7.00 (1H, t, J=7.8Hz), 5.03 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.34-2.17 (4H, m), 2.13-1.96 (2H, m), 1.83-1.64 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 441 (M+1) | |

表 14

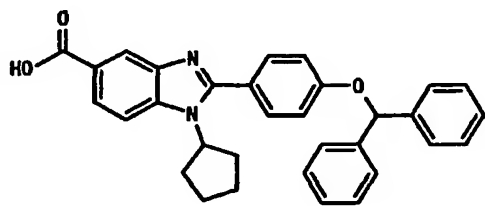
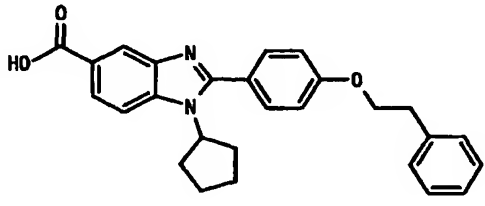
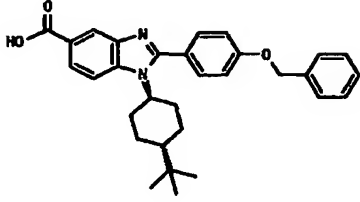
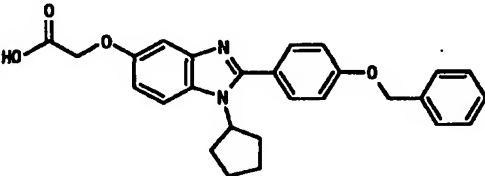
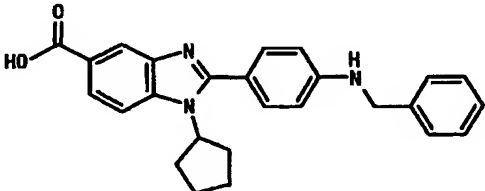
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 70 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, d, J=1.2Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.20 (12H, m), 6.74 (1H, s), 4.92 (1H, quint, J=8.9Hz), 2.30-1.58 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 489 (M+1) | |
| 実施例番号 | 71 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.76 (2H, d, J=8.6Hz), 7.44-7.19 (7H, m), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 4.35 (2H, t, J=6.7Hz), 3.10 (2H, t, J=6.7Hz), 2.32-1.60 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 427 (M+1) | |
| 実施例番号 | 72 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.75 (2H, d, J=8.7Hz), 7.51 (2H, d, J=7.2Hz), 7.46-7.33 (5H, m), 5.27 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.50-2.25 (2H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.95-1.85 (2H, m), 1.35 (1H, m), 1.20-1.10 (2H, m), 0.87 (9H, s) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 483 (M+1) | |

表 15

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 73 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 7.59 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.35 (6H, m), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 7.14 (1H, d, J=2.1Hz), 6.90 (1H, dd, J=9.0, 2.4Hz), 5.21 (2H, s), 4.83 (1H, quint, J=8.7Hz), 4.70 (2H, s), 2.30-1.90 (6H, m), 1.75-1.55 (2H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 443 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 74 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.06 and 7.97 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.57 and 6.86 (4H, A'B'q, J=8.9Hz), 7.42-7.26 (5H, m), 5.04 (1H, quint, J=9.0Hz), 4.42 (2H, s), 2.32-1.94 (6H, m), 1.80-1.62 (2H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 412 (M+1) | |

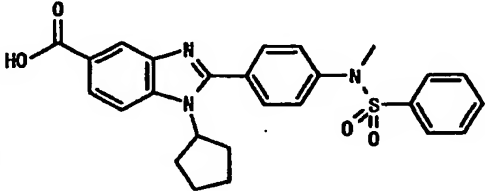
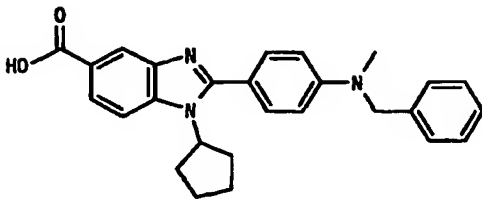
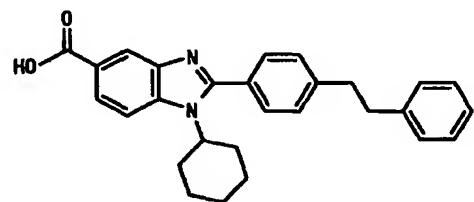
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 75 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, s), 8.26 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=9.2Hz), 7.76-7.60 (8H, m), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 4.84 (1H, quint, J=8.8Hz), 3.23 (3H, s), 2.32-1.90 (6H, m), 1.78-1.61 (2H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 476 (M+1) | |

表 16

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 76 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.07 and 7.49 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.66 and 7.00 (4H, A'B'q, J=7.7Hz), 7.39-7.24 (5H, m), 5.05 (1H, quint, J=8.8Hz), 4.76 (2H, s), 3.21 (3H, s), 2.35-1.92 (6H, m), 1.81-1.62 (2H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 426 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 77 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.56 and 7.43 (4H, ABq, J=8.1Hz), 7.34-7.16 (5H, m), 4.25 (1H, brt, J=12.5Hz), 3.06-2.92 (4H, m), 2.41-2.17 (2H, m), 1.96-1.77 (4H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 425 (M+1) | |

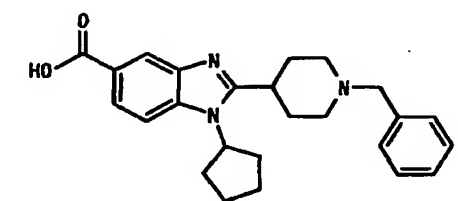
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 78 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.14 (1H, s), 7.79 (1H, d, J=9.0Hz), 7.57 (1H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.20 (5H, m), 4.89 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.54 (2H, s), 3.19-2.90 (3H, m), 2.23-1.69 (14H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 404 (M+1) | |

表 17

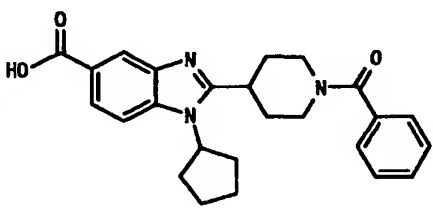
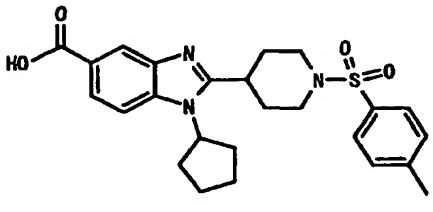
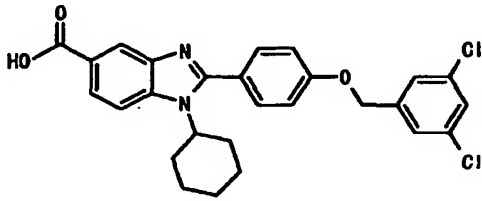
| 実施例番号 | 79 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.15 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.59 (1H, d, J=9.0Hz), 7.50-7.38 (5H, m), 5.05 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.85-2.95 (3H, m), 2.20-1.65 (14H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 418 (M+1) | |
| 実施例番号 | 80 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.17 (1H, m), 7.84 (1H, d, J=8.4Hz), 7.78-7.62 (3H, m), 7.49 (2H, d, J=8.1Hz), 5.05-4.91 (1H, m), 3.80-3.70 (2H, m), 3.30-3.12 (1H, m), 2.48-2.31 (5H, m), 2.15-1.60 (12H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 468 (M+1) | |
| 実施例番号 | 81 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 12.75 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.49 (1H, d, J=8.6Hz), 7.85 (1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.70-7.55 (5H, m), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 5.25 (2H, s), 4.36-4.15 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 495 (M+1) | |

表 18

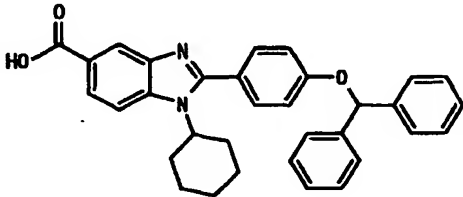
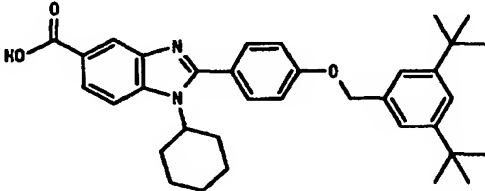
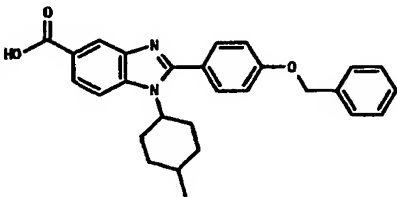
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 82 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.22 (1H, d, J=8.7Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.50 (4H, m), 7.45-7.25 (8H, m), 6.75 (1H, s), 4.21-4.23 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.10-1.78 (4H, m), 1.70-1.15 (4H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 503 (M+1) | |
| 実施例番号 | 83 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.2 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74 (2H, d, J=8.6Hz), 7.40-7.33 (5H, m), 5.22 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.50-1.40 (10H, m), 1.31 (18H, s). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 539 (M+1) | |
| 実施例番号 | 84 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | mixture of isomers (cis:trans=3:1) 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.20-7.95 (2H, m), 7.72 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.29 (7H, m), 5.25 (2H, s), 4.34, 3.40 (1H, m), 2.50-2.20 (2H, m), 2.05-1.50 (6H, m), 1.14, 0.90 (3H, d, J=6.9, 6.3Hz), 1.09 (1H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 441 (M+1) | |

表 19

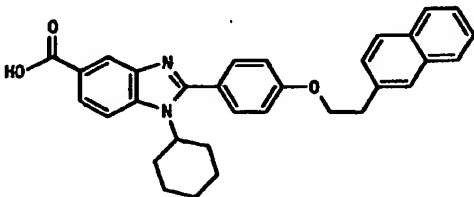
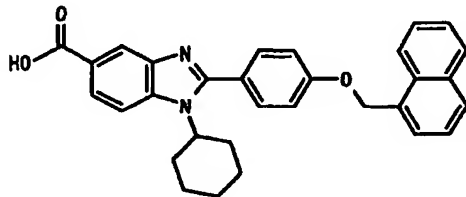
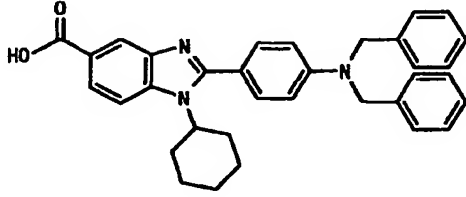
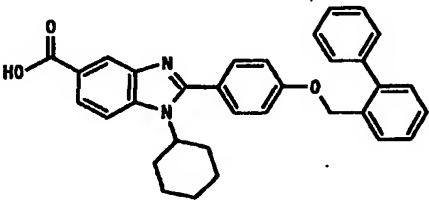
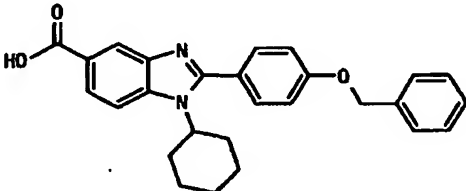
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 85 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.14-7.83 (6H, m), 7.77-7.44 (5H, m), 7.21 (2H, d, J=7.8Hz), 4.44 (2H, brt), 4.31 (1H, brt), 3.56 (2H, brt), 2.20-2.16 (2H, m), 2.00-1.74 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.45-1.14 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 491 (M+1) | |
| 実施例番号 | 86 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=7.6Hz), 8.02-7.53 (10H, m), 7.32 (2H, d, J=8.7Hz), 5.68 (2H, s), 4.32 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 2.01-1.78 (4H, m), 1.71-1.56 (1H, m), 1.50-1.16 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 477 (M+1) | |
| 実施例番号 | 87 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.16 (1H, s), 7.91 and 7.82 (2H, ABq, J=8.5Hz), 7.44 and 6.86 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.39-7.26 (10H, m), 4.82 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.35-2.16 (2H, m), 1.97-1.75 (4H, m), 1.69-1.56 (1H, m), 1.45-1.16 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 516 (M+1) | |

表 20

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 88 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31(1H, s), 8.26and8.06(2H, ABq, J=8.9Hz), 7.73and7.22(4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.50-7.36(8H, m), 5.10(2H, s), 4.37(1H, brt, J=12.2Hz), 2.38-2.28(2H, m), 2.10-1.80(4H, m), 1.70-1.56(1H, m), 1.50-1.20(3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 503 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|------------|---------------|
| 実施例番号 | 89 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | |
| 純度 | 91% (HPLC) | |
| MS | 427 (M+1) | |

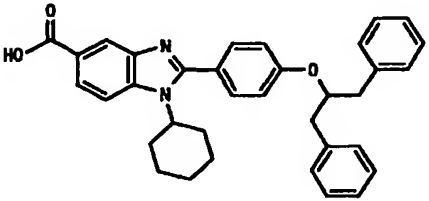
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 90 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.40-8.20(2H, m), 8.04(1H, d, J=8.4Hz), 7.65(2H, d, J=8.4Hz), 7.50-7.10(12H, m), 5.08(1H, m), 4.33(1H, m), 3.00(4H, m), 2.50-1.10(10H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 531 (M+1) | |

表 21

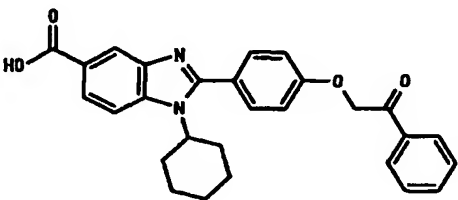
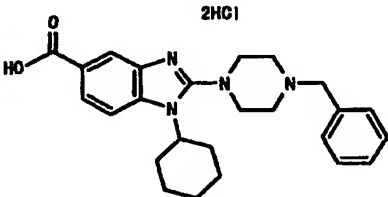
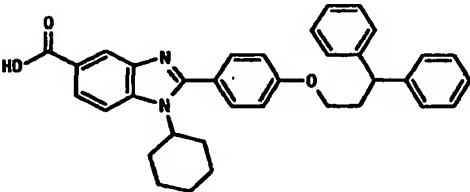
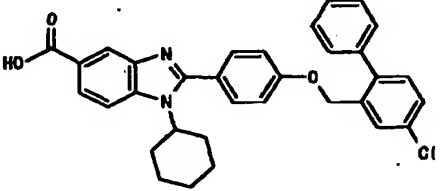
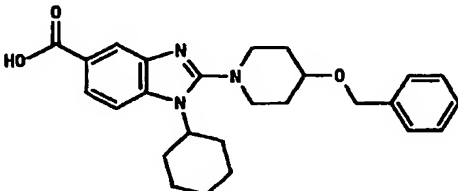
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 91 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.08-8.03 (3H, m), 7.77-7.58 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.7Hz), 5.81 (2H, s), 4.40 (1H, m), 2.50-1.20 (10H, m). |
|  | | |
| 純度 | 約 90 % (NMR) | |
| MS | 455 (M+1) | |
| 実施例番号 | 92 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 11.8 (1H, brs), 8.07 (1H, s), 7.89 (1H, d, J=8.7Hz), 7.84 (1H, d, J=8.4Hz), 7.69 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.42 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.73 (4H, m), 3.40 (4H, m), 2.40-1.40 (10H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 419 (M+1) | |
| 実施例番号 | 93 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.9Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.38 (4H, d, J=7.2Hz), 7.31 (4H, t, J=7.3Hz), 7.21-7.17 (4H, m), 4.37 (1H, m), 4.26 (1H, t, J=7.9Hz), 4.01 (2H, t, J=6.2Hz), 2.57 (2H, m), 2.50-2.20 (2H, m), 2.10-2.00 (2H, m), 2.00-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 531 (M+1) | |

表 22

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 94 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.75-7.70 (3H, m), 7.56 (1H, d, J=8.4Hz), 7.55-7.35 (6H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 537 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 95 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300Hz, DMSO-d6 12.9 (1H, brs), 8.02 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.40-7.25 (5H, m), 4.58 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.71 (1H, m), 3.49 (2H, m), 3.21 (2H, m), 2.35-1.30 (14H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 434 (M+1) | |

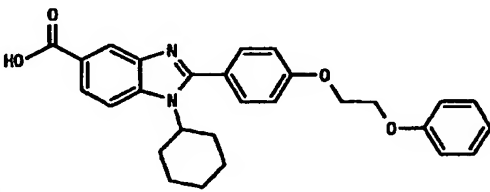
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 96 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.3Hz), 8.27 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, d, J=8.8Hz), 7.76 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.25 (4H, m), 7.06-6.90 (3H, m), 4.53-4.26 (5H, m), 2.40-2.18 (2H, m), 2.12-1.56 (5H, m), 1.50-1.19 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 457 (M+1) | |

表 23

| | | |
|-------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 97 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, d, J=1.3Hz), 8.29 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, dd, J=8.8, 1.3Hz), 8.42 (2H, d, J=8.8Hz), 7.37-7.16 (7H, m), 4.48-4.30 (1H, m), 4.12 (2H, t, J=6.2Hz), 2.83-2.70 (2H, m), 2.40-1.50 (9H, m), 1.59-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 455 (M+1) | |

| | | |
|-------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 98 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, d, J=1.3Hz), 8.21 (1H, d, J=8.8Hz), 8.01 (1H, d, J=10.1Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33-7.12 (7H, m), 4.44-4.28 (1H, m), 4.10 (2H, t, J=6.3Hz), 2.62 (2H, t, J=7.4Hz), 2.39-2.15 (2H, m), 2.10-1.18 (14H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 483 (M+1) | |

| | | |
|-------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 99 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.93 (1H, brs), 8.30 (1H, d, J=1.4Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.59-7.34 (5H, m), 7.07 (1H, s), 5.38 (2H, s), 4.78-4.60 (1H, m), 2.32-2.14 (2H, m), 2.03-1.28 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 418 (M+1) | |

表 24

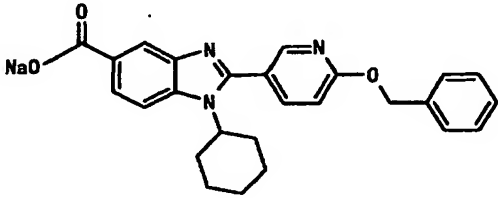
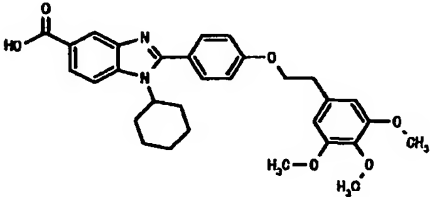
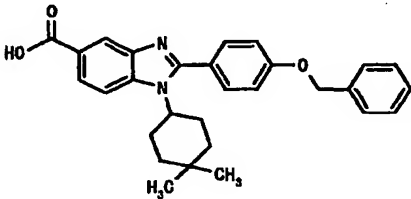
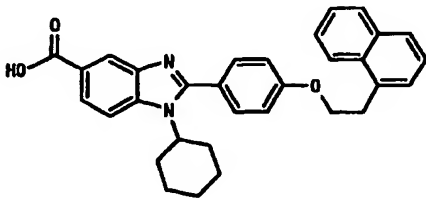
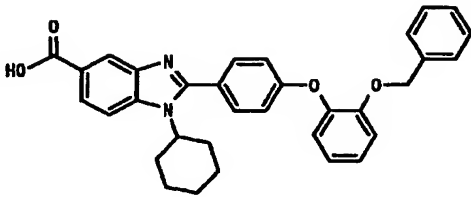
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 100 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.46 (1H, d, J=2.1Hz), 8.16 (1H, s), 8.00 (1H, dd, J=8.5, 2.1Hz), 7.87 (1H, d, J=8.5Hz), 7.68 (1H, d, J=8.5Hz), 7.55-7.30 (5H, m), 7.08 (1H, d, J=8.5Hz), 5.45 (2H, s), 4.25-4.08 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.45-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 427 (M+1) | |
| 実施例番号 | 101 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.31 (1H, d, J=6.9Hz), 8.06 (1H, d, J=8.4Hz), 7.76 and 7.29 (4H, ABq, J=8.9Hz), 6.68 (2H, s), 4.37 (1H, m), 4.35 (2H, t, J=7.0Hz), 3.79 (6H, s), 3.63 (3H, s), 3.04 (2H, t, J=6.9Hz), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.65 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 531 (M+1) | |
| 実施例番号 | 102 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.88 (1H, s), 8.34 (1H, s), 7.86 (1H, d, J=8.5Hz), 7.73 (1H, d, J=8.5Hz), 7.63 and 7.23 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.52-7.35 (5H, m), 5.22 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39 (2H, m), 1.79 (2H, m), 1.53 (2H, m), 1.31 (2H, m), 1.11 (3H, s), 0.95 (3H, s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 455 (M+1) | |

表 25

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 103 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.79 (1H, brs), 8.22 (2H, s), 8.02-7.78 (4H, m), 7.63-7.42 (6H, m), 7.20-7.09 (2H, m), 4.43 (2H, s), 4.27 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.59 (2H, s), 2.39-2.15 (2H, m), 1.98-1.72 (4H, m), 1.68-1.59 (1H, m), 1.43-1.12 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 491 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 104 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.64 and 7.05 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.32-7.09 (9H, m), 5.13 (2H, s), 4.28 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.36-2.19 (2H, m), 1.95-1.77 (4H, m), 1.66-1.56 (1H, m), 1.46-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 519 (M+1) | |

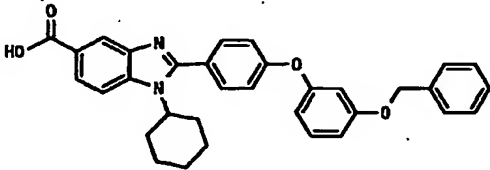
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 105 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.68 and 7.17 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.46-7.33 (6H, m), 6.93 and 6.75 (2H, A'B'q, J=8.2Hz), 6.82 (1H, s), 5.13 (2H, s), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.39-2.18 (2H, m), 1.98-1.77 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.48-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 519 (M+1) | |

表 26

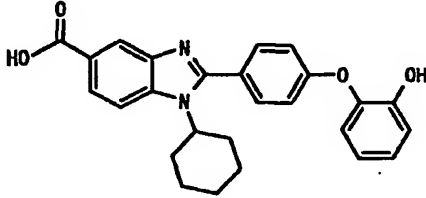
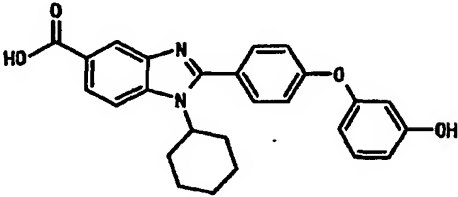
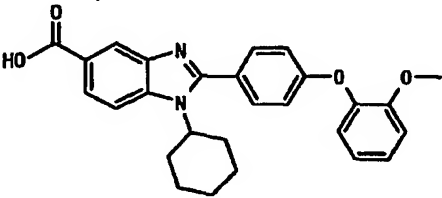
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 106 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.89 (1H, brs), 9.73 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.03 and 7.91 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.66 and 7. 04 (4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7. 16-7.03 (3H, m), 6.89 (2H, t, J=9.2Hz), 4.33 (1H, brt, J=1 2.2Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2. 00-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 429 (M+1) | |
| 実施例番号 | 107 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.98 (1H, brs), 9.82 (1H, br s), 8.27 (1H, s), 8.09 and 7.9 4 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.74 and 7.22 (4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.28-7.22 (1H, m), 6.67-6.5 4 (3H, m), 4.35 (1H, brt, J=12 .2Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2. 05-1.80 (4H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 429 (M+1) | |
| 実施例番号 | 108 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 8.01 and 7.90 (2 H, ABq, J=8.7Hz), 7.65 and 7. 03 (4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.3 2-7.20 (3H, m), 7.08-7.03 (1 H, m), 4.32 (1H, brt, J=12.2H z), 3.77 (3H, s), 2.36-2.20 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1. 71-1.59 (1H, m), 1.44-1.11 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 443 (M+1) | |

表 27

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 109 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=9.0 Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.37 (1H, t, J=7.1 Hz), 6.84-6.70 (3H, m), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.78 (3H, s), 2.39-2.20 (2H, m), 1.98-1.78 (4H, m), 1.76-1.60 (1H, m), 1.48-1.13 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 443 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 110 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 and 8.04 (2H, ABq, J=8.8 Hz), 7.75 and 7.71 (4H, A'B'q, J=8.8 Hz), 7.32-7.03 (4H, m), 4.34 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=6.3 Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 2.11-1.81 (4H, m), 1.72-1.16 (6H, m), 0.71 (3H, t, J=7.3 Hz) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 111 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.91 and 7.87 (2H, ABq, J=8.7 Hz), 7.68 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.7 Hz), 7.35 (1H, t, J=8.5 Hz), 6.80 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.72-6.68 (2H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=6.5 Hz), 2.39-2.18 (2H, m), 1.97-1.58 (7H, m), 1.45-1.20 (3H, m), 0.97 (3H, t, J=7.4 Hz) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |

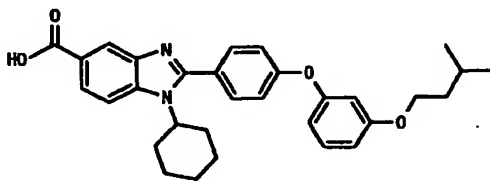
表 28

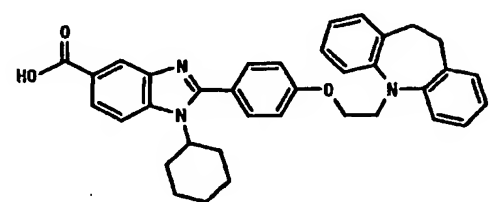
| | | |
|-------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 112 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=9.3 Hz), 7.61 and 7.01 (4H, A' B' q, J=8.6 Hz), 7.25-7.00 (4H, m), 5.25 (2H, brs), 4.55 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.29 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.38-2.18 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.56 (1H, m), 1.67 (3H, s), 1.60 (3H, s), 1.48-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 497 (M+1) | |

| | | |
|-------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 113 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.9 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A' B' q, J=8.9 Hz), 7.35 (1H, t, J=8.3 Hz), 6.81-6.69 (3H, m), 5.41 (2H, brs), 4.54 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.41-2.18 (2H, m), 1.98-1.76 (4H, m), 1.73 (3H, s), 1.70-1.58 (1H, m), 1.68 (3H, s), 1.45-1.17 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 497 (M+1) | |

| | | |
|-------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 114 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=8.4 Hz), 7.60 and 6.99 (4H, A' B' q, J=8.6 Hz), 7.29-7.00 (4H, m), 4.29 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.99 (2H, t, J=6.3 Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 1.95-1.76 (4H, m), 1.70-1.14 (7H, m), 0.76 (3H, d, J=6.6 Hz) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 499 (M+1) | |

表 29

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 115 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.35 (1H, t, J=7.8Hz), 6.82-6.69 (3H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 4.00 (2H, t, J=6.9Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 1.97-1.54 (8H, m), 1.47-1.20 (3H, m), 0.93 (6H, d, J=6.6Hz) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 499 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 116 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.9Hz), 8.03 (1H, d, J=8.8Hz), 7.68 (2H, d, J=8.8Hz), 7.24 (2H, d, J=7.2Hz), 7.19-7.10 (6H, m), 6.94 (2H, t, J=7.2Hz), 4.34 (1H, m), 4.19 (4H, brs), 3.10 (4H, brs), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 557 (M+1) | |

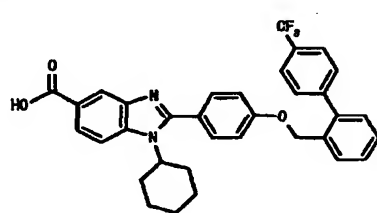
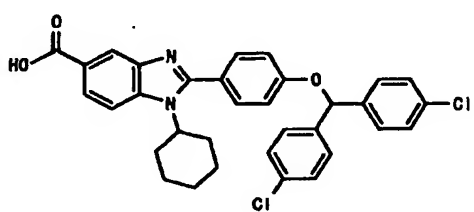
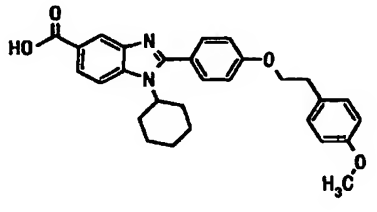
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 117 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.80 (2H, d, J=8.2Hz), 7.72-7.67 (3H, m), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54-7.51 (2H, m), 7.42-7.41 (1H, m), 7.11 (2H, d, J=8.8Hz), 5.09 (2H, s), 4.27 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 571 (M+1) | |

表 30

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 118 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.3 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.9Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.8Hz), 7.57 (4H, d, J=8.6Hz), 7.47 (4H, d, J=8.6Hz), 7.33 (2H, d, J=8.9Hz), 6.84 (1H, s), 4.33 (1H, m), 2.45-2.10 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.95-1.70 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 571 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 119 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32-8.30 (2H, m), 8.07-8.03 (1H, m), 7.74 and 6.90 (4H, ABq, J=8.7Hz), 4.37 (1H, m), 4.31 (2H, t, J=6.8Hz), 3.74 (3H, s), 3.04 (2H, t, J=6.7Hz), 2.30 (2H, m), 2.02 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.63 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |

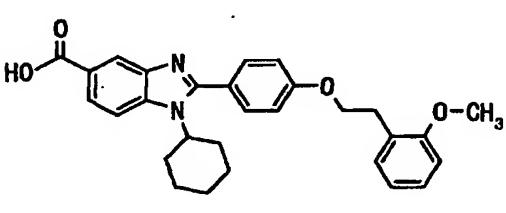
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 120 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.61 and 7.16 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.30-7.22 (2H, m), 7.01 (2H, d, J=8.1Hz), 6.92 (1H, t, J=7.5Hz), 4.28 (1H, m), 4.25 (2H, t, J=7.2Hz), 3.83 (3H, s), 3.07 (2H, t, J=7.1Hz), 2.28 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |

表 31

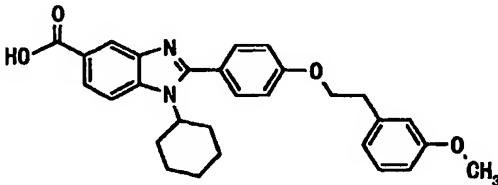
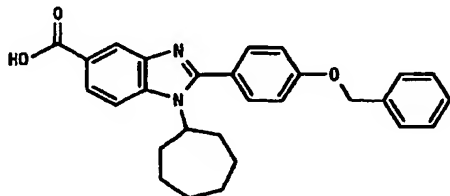
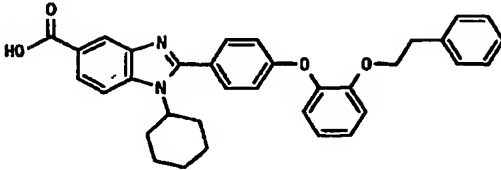
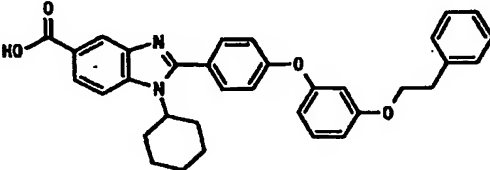
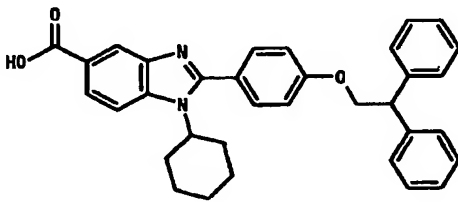
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 121 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90 (1H, d, J=8.6Hz), 7.62 and 7. 17 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.24 (1H, m), 6.94 (2H, m), 6.82 (1 H, m), 4.32 (2H, t, J=6.7Hz), 3.76 (3H, s), 3.07 (2H, t, J=6 .7Hz), 2.29 (2H, m), 2.00-1. 75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m) , 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |
| 実施例番号 | 122 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.87 (2H, m), 7.62 (2H, d, J=8 .1Hz), 7.60-7.20 (7H, m), 5. 23 (2H, s), 4.46 (1H, m), 2.50 -2.30 (2H, m), 1.70-1.40 (10 H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 441 (M+1) | |
| 実施例番号 | 123 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=9 .0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.4Hz) , 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40 -7.05 (9H, m), 7.03 (2H, d, J= 8.4Hz), 4.31 (1H, m), 4.18 (2 H, t, J=6.6Hz), 2.81 (2H, t, J =6.3Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.70 (4H, m), 1.70-1.5 0 (1H, m), 1.50-1.05 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 533 (M+1) | |

表 32

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 124 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.29 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.20 (8H, m) , 6.84 (1H, d, J=9.3Hz), 6.75 -6.72 (2H, m), 4.36 (1H, m), 4 .22 (2H, t, J=6.8Hz), 3.04 (2 H, t, J=6.7Hz), 2.40-2.15 (2 H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.9 5-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1 H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 533 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 125 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8 .7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz) , 7.73 (2H, d, J=9.0Hz), 7.43 (4H, d, J=7.2Hz), 7.36-7.20 (8H, m), 4.74 (2H, d, J=7.5Hz , 4.57 (1H, t, J=7.5Hz), 4.3 8 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.8 5 (2H, m), 1.85-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 517 (M+1) | |

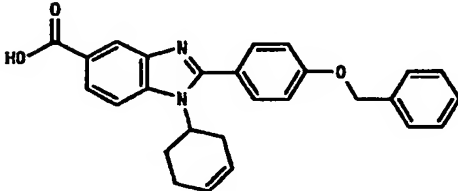
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 126 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8 .7Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz) , 7.77 (2H, d, J=9.0Hz), 7.52 -7.31 (7H, m), 5.74 (2H, m), 5 .26 (2H, s), 4.61 (1H, m), 2.9 6 (1H, m), 2.60-2.10 (5H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 425 (M+1) | |

表 33

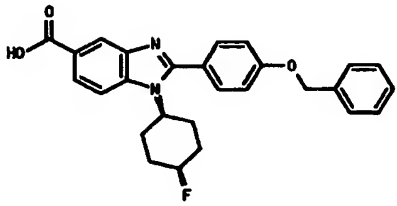
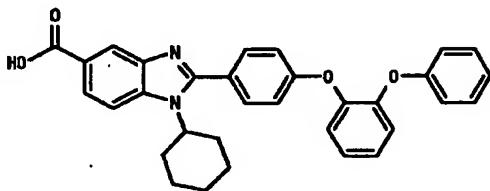
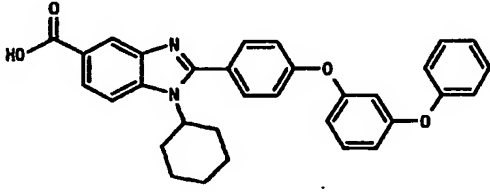
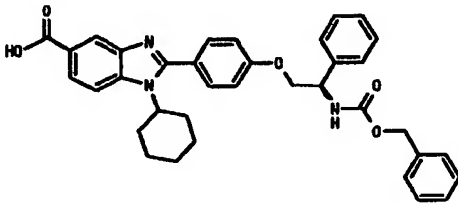
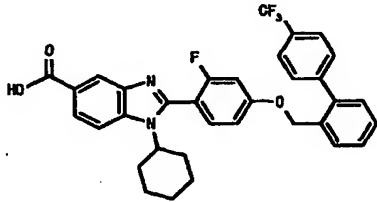
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 127 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.2 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=8.8Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.32 (7H, m), 5.26 (2H, s), 4.92 (1H, d, J=49.4Hz), 4.57 (1H, m), 2.65-2.35 (2H, m), 2.25-1.50 (6H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 445 (M+1) | |
| 実施例番号 | 128 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.92 and 7.85 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.61 and 7.06 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.36-6.91 (9H, m), 4.24 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.35-2.15 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.14 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 505 (M+1) | |
| 実施例番号 | 129 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.92 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.22 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.52-7.39 (1H, m), 7.47 and 7.41 (2H, A'B'q, J=8.1Hz), 6.91 (1H, d, J=8.0Hz), 6.89 (1H, d, J=8.2Hz), 6.75 (1H, s), 4.36-4.18 (1H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 1.95-1.76 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.44-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 505 (M+1) | |

表 34

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 130 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 7.69 (2H, d, J=8.6Hz), 7.49-7.21 (11H, m), 5.08 and 5.03 (2H, ABq, J=12.6Hz), 5.07-4.99 (1H, m), 4.26 (2H, d, J=6.6Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2.04-1.77 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 590 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 131 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=9.0Hz), 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.80 (2H, d, J=8.1Hz), 7.72-7.41 (7H, m), 7.12 (1H, d, J=12.6Hz), 7.01 (1H, d, J=8.4Hz), 5.12 (2H, s), 4.06 (1H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.60-1.20 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 589 (M+1) | |

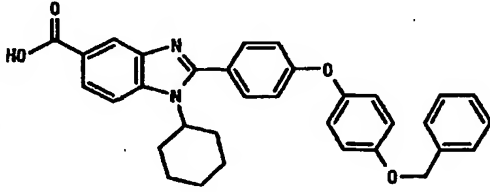
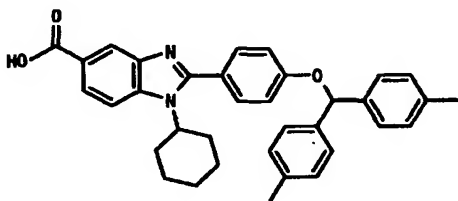
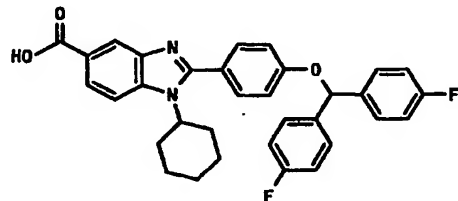
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 132 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.66 (2H, d, J=8.6Hz), 7.49-7.33 (5H, m), 7.17-7.05 (6H, m), 5.12 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.20 (8H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 519 (M+1) | |

表 35

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 133 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.57 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, d, J=8.7Hz), 7.51 (2H, d, J=8.7Hz), 7.31 (4H, d, J=8.0Hz), 7.16 (4H, d, J=8.0Hz), 7.09 (2H, d, J=8.7Hz), 6.26 (1H, s), 4.37 (1H, m), 2.41-2.28 (2H, m), 2.33 (6H, s), 2.03-1.84 (4H, m), 1.77 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 531 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 134 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 8.59 (1H, d, J=1.5Hz), 8.02 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.68 (1H, d, J=8.7Hz), 7.54 (2H, d, J=8.8Hz), 7.39 (4H, dd, J=8.7, 5.3Hz), 7.08 (4H, d, J=8.7Hz), 7.05 (2H, d, J=8.8Hz), 6.29 (1H, s), 4.36 (1H, m), 2.43-2.19 (2H, m), 2.04-1.85 (4H, m), 1.78 (1H, m), 1.45-1.23 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 539 (M+1) | |

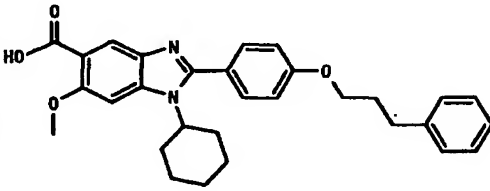
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 135 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.34 (1H, brs), 7.93 (1H, s), 7.55 (1H, d, J=8.6Hz), 7.33-7.15 (6H, m), 7.11 (2H, d, J=8.6Hz), 4.30-4.20 (1H, m), 4.07 (2H, t, J=6.3Hz), 3.93 (3H, s), 2.78 (2H, t, J=7.4Hz), 2.35-2.19 (2H, m), 2.12-2.00 (2H, m), 1.91-1.79 (4H, m), 1.69-1.60 (1H, m), 1.47-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 485 (M+1) | |

表 36

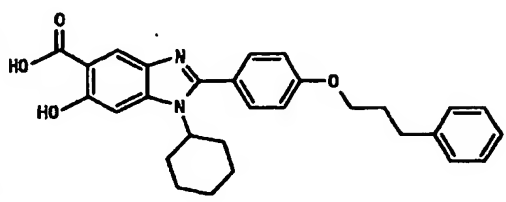
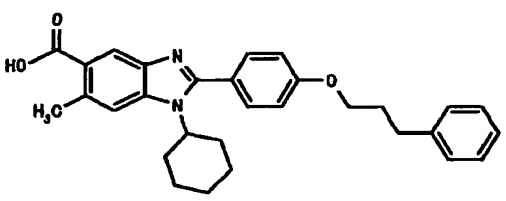
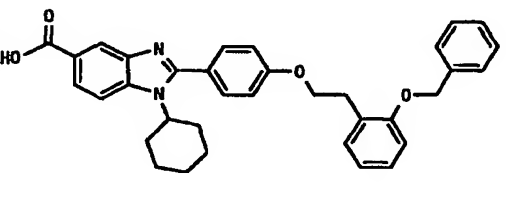
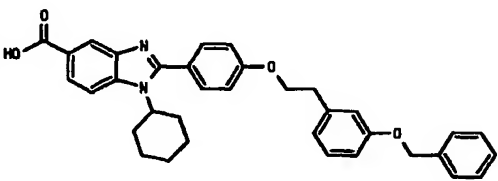
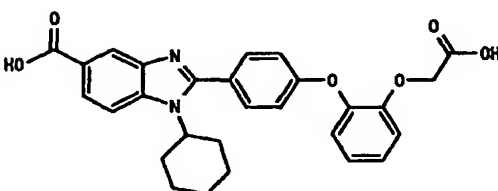
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 136 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.13 (1H, s), 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.63 (1H, s), 7.35-7.12 (7H, m), 4.35-4.20 (1H, m), 4.10 (1H, t, J=6.3Hz), 2.78 (2H, t, J=7.5Hz), 2.33-1.78 (8H, m), 1.70-1.16 (4H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 471 (M+1) | |
| 実施例番号 | 137 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.76 (2H, d, J=9.0Hz), 7.37-7.16 (7H, m), 4.43-4.30 (1H, m), 4.13 (2H, t, J=6.3Hz), 2.84-2.68 (5H, m), 2.42-2.22 (2H, m), 2.18-1.80 (6H, m), 1.70-1.20 (4H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 469 (M+1) | |
| 実施例番号 | 138 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.76 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.54-7.49 (4H, m), 7.42-7.21 (5H, m), 7.11-7.09 (3H, m), 6.93 (1H, m), 5.17 (2H, s), 4.29 (3H, m), 3.11 (2H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 1.99-1.23 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 547 (M+1) | |

表 37

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 139 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73 (1H, m), 7.60-7.57 (2H, m), 7 .47-6.90 (1H, m), 5.11 (2H, s) , 4.33-4.28 (3H, m), 3.09-3 .04 (2H, t, J=6.7Hz), 2.35-2 .20 (2H, m), 1.95-1.10 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 547 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 140 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.83 (2H, brs), 8.22 (1H, s) , 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.4Hz), 7.63-7.60 (2H, m), 7.26-7.03 (6H, m), 4 .73 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.4 0-2.15 (2H, m), 2.00-1.20 (8 H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 487 (M+1) | |

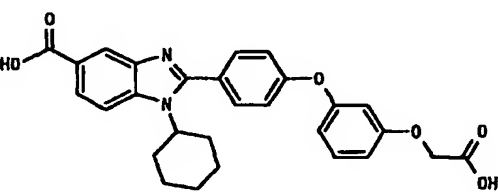
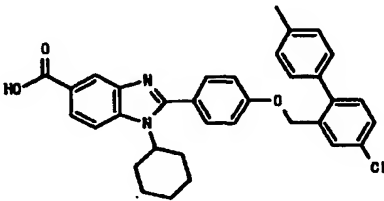
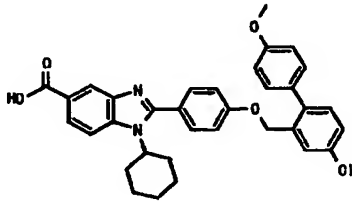
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 141 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.87 (1H, brs), 8.24 (1H, s) , 7.97 (1H, d, J=9.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 and 7. 19 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.36 (1 H, t, J=8.7Hz), 6.80-6.72 (3 H, m), 4.71 (2H, s), 4.32 (1H , m), 2.29 (2H, m), 1.95-1.25 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 487 (M+1) | |

表 38

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 142 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz), 7.76-7.72 (3H, m), 7.54 (1H, d, J=8.4Hz), 7.39-7.22 (7H, m), 5.11 (1H, s), 4.36 (1H, m), 2.35 (3H, s), 2.35-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 551 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 143 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=8.8Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74-7.71 (3H, m), 7.52 (1H, d, J=8.3Hz), 7.40-7.36 (3H, m), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 7.01 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.79 (3H, s), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 567 (M+1) | |

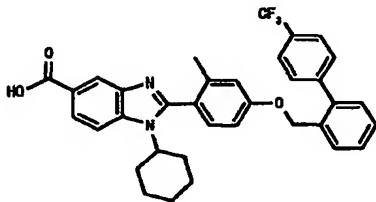
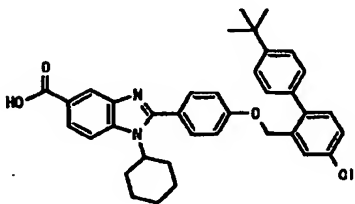
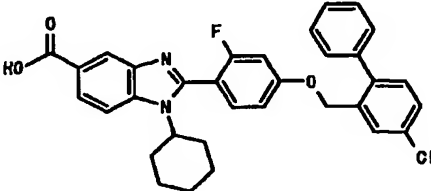
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 144 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.0 (1H, brs), 8.31 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.3Hz), 7.70-7.66 (3H, m), 7.55-7.40 (4H, m), 7.03-6.95 (2H, m), 5.08 (2H, s), 4.03 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.18 (3H, s), 2.05-1.70 (4H, m), 1.70-1.50 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 585 (M+1) | |

表 39

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 145 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73-7.71 (3H, m), 7.54 (1H, d, J=8.3Hz), 7.48 (2H, d, J=8.4Hz), 7.41-7.37 (3H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.34 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m), 1.31 (9H, s). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 593 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 146 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.6Hz), 7.76 (1H, d, J=2.1Hz), 7.63 (1H, t, J=8.5Hz), 7.57 (1H, d, J=8.2), 7.55-7.35 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=12.1Hz), 7.02 (1H, d, J=8.6Hz), 5.10 (2H, s), 4.07 (1H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.70 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 555 (M+1) | |

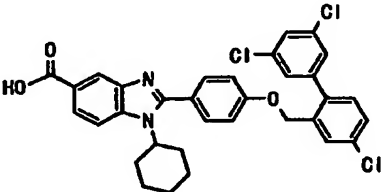
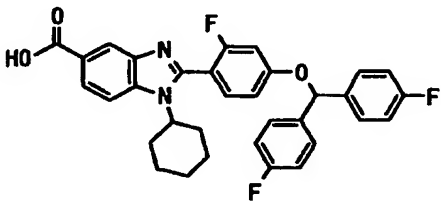
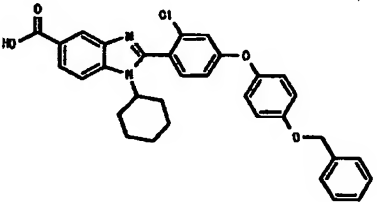
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 147 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDCl3 8.61 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, d, J=2.4Hz), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.42 (1H, d, J=8.0), 7.38 (1H, t, J=1.8Hz), 7.28 (2H, d, J=1.8Hz), 7.26 (1H, d, J=8.0Hz), 7.03 (2H, d, J=8.7Hz), 4.94 (2H, s), 4.37 (1H, m), 2.43-2.21 (2H, m), 2.17-1.86 (4H, m), 1.79 (1H, m), 1.43-1.26 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 605 (M+1) | |

表 40

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 148 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (s, 1H), 7.89 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.63-7.46 (5H, m), 7.30-7.12 (5H, m), 7.08 (1H, d, J=11.0Hz), 6.81 (1H, s), 3.92 (1H, m), 2.15-2.06 (2H, m), 1.89-1.72 (4H, m), 1.61 (1H, m), 1.42-1.09 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 557 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 149 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=9.0Hz), 7.88 (1H, dd, J=9.0, 1.5Hz), 7.58 (1H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.30 (5H, m), 7.22-7.00 (6H, m), 5.13 (2H, s), 3.98-3.80 (1H, s), 2.36-1.10 (10H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1) | |

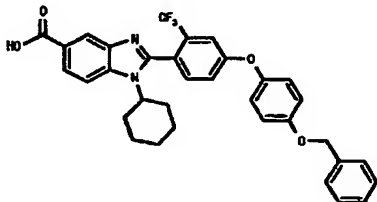
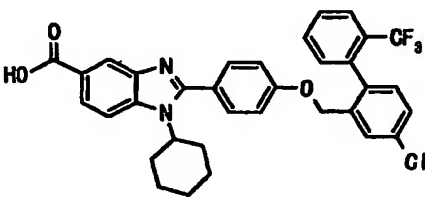
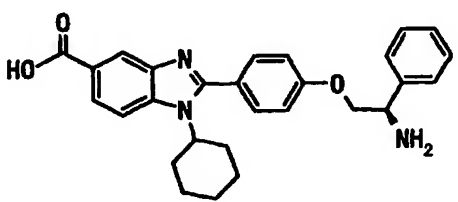
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 150 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 8.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.88 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.28 (7H, m), 7.23 (2H, d, J=9.3Hz), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 3.90-3.72 (1H, m), 2.20-1.10 (10H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 587 (M+1) | |

表 41

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 151 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.18 (1H, s), 7.92-7.78 (3H, m), 7.78-7.58 (3H, m), 7.58-7.44 (4H, m), 7.29 (1H, d, J=8.2Hz), 7.01 (2H, d, J=8.7Hz), 4.88 (1H, d, J=11.8Hz), 4.80 (1H, d, J=11.8Hz), 4.22 (1H, m), 2.37-2.16 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.48-1.14 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 605 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 152 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (2H, m), 7.99-7.80 (2H, m), 7.63-7.08 (9H, m), 4.20-3.98 (4H, m), 2.20-2.15 (2H, m), 1.95-1.74 (4H, m), 1.70-1.54 (1H, m), 1.44-1.14 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 456 (M+1) | |

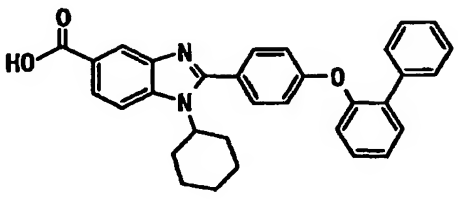
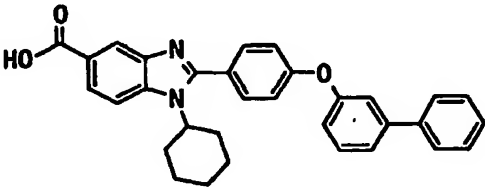
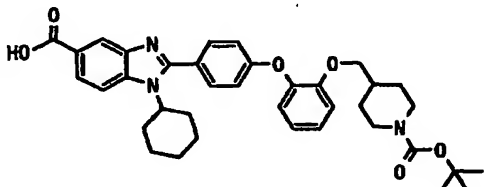
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 153 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.20 (1H, s), 8.93 and 7.83 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.86-7.21 (11H, m), 7.03 (2H, d, J=8.7Hz), 4.20 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.32-2.13 (2H, m), 1.92-1.74 (4H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.45-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 489 (M+1) | |

表 42

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 154 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.72-7.16 (13H, m), 5.25 (2H, brs), 4.55 (2H, d, J=6.6Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.18 (2H, m), 1.98-1.77 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 489 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 155 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.85 and 7.61 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.61 and 6.99 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.28-7.18 (1H, m), 7.25 (2H, d, J=7.5Hz), 7.07-6.99 (1H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.83 (2H, d, J=6.0Hz), 3.82-3.72 (1H, m), 2.68-2.49 (2H, m), 2.39-2.21 (2H, m), 1.95-1.80 (4H, m), 1.79-1.60 (2H, m), 1.46-1.22 (5H, m), 1.30 (9H, s), 1.00-0.82 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 626 (M+1) | |

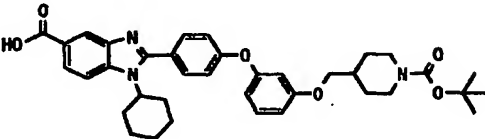
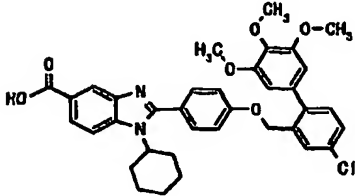
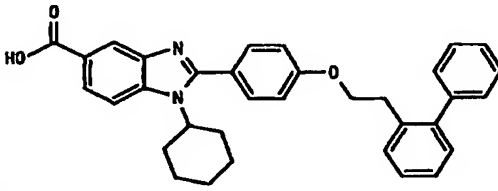
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 156 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.92 and 7.86 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.68 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=8.5Hz), 6.80 (1H, d, J=8.3Hz), 6.72-6.70 (2H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.99 (2H, brd, J=12.0Hz), 3.85 (2H, d, J=6.3Hz), 2.82-2.62 (2H, m), 2.38-2.20 (2H, m), 1.99-1.59 (8H, m), 1.42-1.03 (5H, m), 1.39 (9H, s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 626 (M+1) | |

表 43

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 157 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.78 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.75 (1H, d, J=2.2Hz), 7.60 (2H, d, J=8.4Hz), 7.55 (1H, dd, J=8.3, 2.2Hz), 7.48 (1H, d, J=8.3Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.73 (2H, s), 5.08 (2H, s), 4.23 (1H, m), 3.68 (9H, s), 2.37-2.17 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.65 (1H, s), 1.49-1.15 (3H, m). |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 627 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 158 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.93 (2H, d, J=8.7Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5Hz), 7.53-7.21 (10H, m), 6.94 (2H, d, J=8.7Hz), 4.30-4.12 (3H, m), 3.05 (2H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 517 (M+1) | |

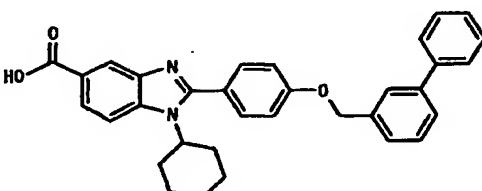
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 159 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.95 (1H, d, 8.6Hz), 7.86 (1H, d, 8.6Hz), 7.80 (1H, s), 7.70-7.35 (10H, m), 7.27 (2H, d, J=8.7Hz), 5.30 (2H, s), 4.28 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 503 (M+1) | |

表 44

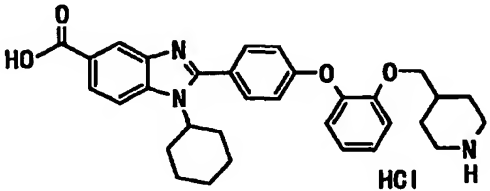
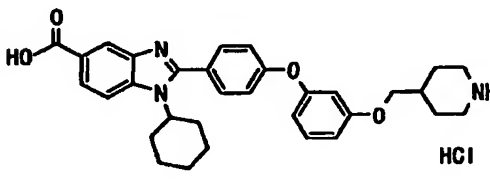
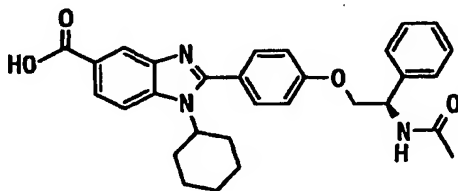
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 160 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.90 (1H, brs), 8.59 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.18 and 8.00 (2H, ABq, J=8.5Hz), 7.73 and 7.10 (4H, A' B' q, J=8.5Hz), 7.32-7.05 (4H, m), 4.35 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.86 (2H, d, J=6.3Hz), 3.25-3.08 (2H, m), 2.85-2.66 (2H, m), 2.40-2.28 (2H, m), 2.07-1.14 (15H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 526 (M+1) | |
| 実施例番号 | 161 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 9.05 (1H, brs), 8.76 (1H, brs), 8.31 (1H, s), 8.19 and 8.00 (2H, ABq, J=8.3Hz), 7.79 and 7.25 (4H, A' B' q, J=8.3Hz), 7.39 (1H, brs), 6.86-6.74 (4H, m), 4.37 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=5.0Hz), 3.35-3.18 (2H, m), 2.98-2.75 (2H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 2.16-1.15 (15H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 526 (M+1) | |
| 実施例番号 | 162 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.87 (1H, brs), 8.58 (1H, d, J=6.0Hz), 8.23 (1H, s), 7.99 and 7.80 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.61 and 7.18 (4H, A' B' q, J=8.0Hz), 7.45-7.30 (5H, m), 5.29 (1H, brs), 4.26 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.11 (2H, m), 2.00-1.71 (4H, m), 1.92 (3H, s), 1.70-1.52 (1H, m), 1.45-1.11 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 498 (M+1) | |

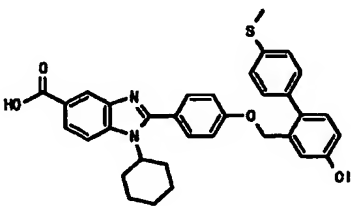
表 45

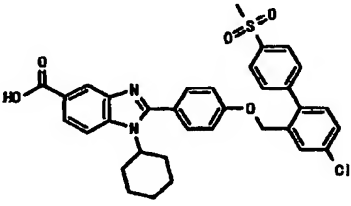
| | | |
|-------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 163 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.35 (1H, t, J=8.6Hz), 6.80 (1H, d, J=7.5Hz), 6.72-6.69 (2H, m), 5.20 (1H, t, J=3.7Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.95 (2H, t, J=6.8Hz), 2.49-2.19 (4H, m), 1.97-1.76 (4H, m), 1.68 (3H, s), 1.67-1.54 (1H, m), 1.61 (3H, s), 1.45-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 511 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 164 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 8.20 (1H, s), 7.87 (2H, s), 7.68 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=7.9Hz), 6.81 (1H, d, J=9.4Hz), 6.72 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=6.8Hz), 4.80 (2H, s), 4.29 (1H, brt, J=12.2Hz), 4.10 (1H, t, J=6.7Hz), 2.43 (1H, t, J=6.7Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 1.97-1.78 (4H, m), 1.76 (3H, s), 1.70-1.56 (1H, m), 1.43-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 497 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 165 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 11.21 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.6Hz), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.78 (2H, d, J=8.7Hz), 7.70-7.67 (2H, m), 7.55-7.42 (3H, m), 7.27 (2H, d, J=8.7Hz), 4.73-4.30 (5H, m), 4.20-3.97 (1H, m), 3.42-3.10 (2H, m), 2.45-1.23 (14H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | | |

表 46

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 166 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, d, J=9.0Hz), 7.73 (1H, d, J=1.8Hz), 7.68 (2H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, d, J=8.4, 2.1Hz), 7.41-7.31 (5H, m), 7.19 (2H, d, J=8.4Hz), 5.10 (2H, s), 4.32 (1H, m), 2.50 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.10 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 583 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 167 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz), 8.00 (2H, d, J=8.4Hz), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (1H, d, J=2.1Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1Hz), 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60 (1H, dd, J=8.1, 2.1Hz), 7.44 (1H, d, J=8.1Hz), 7.16 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.26 (3H, s), 2.40-1.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 615 (M+1) | |

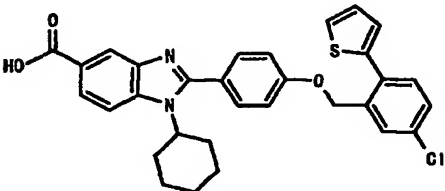
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 168 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80-7.75 (3H, m), 7.69 (1H, d, J=4.1Hz), 7.57 (2H, m), 7.34-7.29 (3H, m), 7.20-7.15 (1H, m), 5.24 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.45-2.20 (2H, m), 2.20-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 543 (M+1) | |

表 47

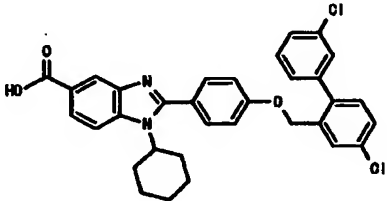
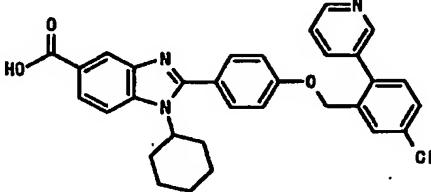
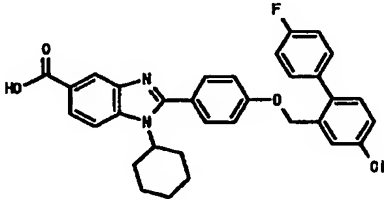
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 169 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.78-7.71 (3H, m), 7.59-7.41 (6H, m), 7.23 (2H, d, J=9.0 Hz), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 571 (M+1) | |
| 実施例番号 | 170 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 8.66 (1H, s), 8.61 (1H, m), 8.21 (1H, s), 7.92-7.79 (4H, m), 7.61-7.56 (3H, m), 7.50-7.43 (2H, m), 7.10 (2H, d, J=8.7Hz), 5.09 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 538 (M+1) | |
| 実施例番号 | 171 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74-7.71 (3H, m), 7.57-7.46 (3H, m), 7.39 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.31-7.21 (4H, m), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 555 (M+1) | |

表 48

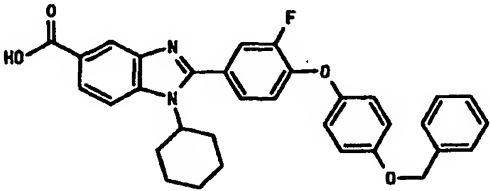
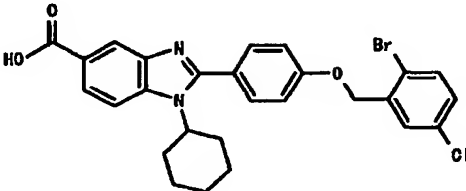
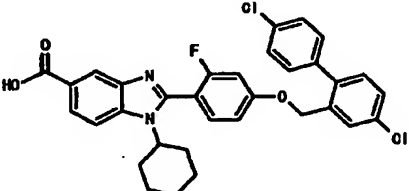
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 172 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, d, J=10.5Hz), 7.70 (1H, dd, J=11.4, 1.8Hz), 7.48-7.32 (6H, m), 7.17-7.09 (5H, m), 5.12 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 537 (M+1) | |
| 実施例番号 | 173 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.82-7.74 (4H, m), 7.45 (1H, dd, J=8.4, 3.0Hz), 7.39 (2H, d, J=8.7Hz), 5.28 (2H, s), 4.40 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 540 (M+1) | |
| 実施例番号 | 174 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.26 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80-7.70 (1H, m), 7.60-7.36 (7H, m), 7.18-6.91 (2H, m), 5.09 (2H, s), 4.11-3.90 (1H, m), 2.32-1.18 (14H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 590 (M+1) | |

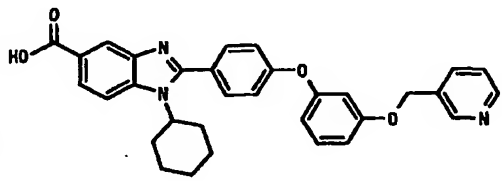
表 49

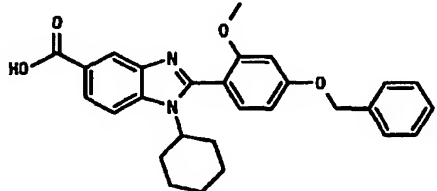
| | | |
|--------------|-----------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 175 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 12.75(1H, s), 8.21(1H, s), 7.94and7.85(2H, ABq, J=8.7Hz), 7.61and7.00(4H, A' B' q, J=8.5Hz), 7.31-6.91(2H, m), 7.25(2H, d, J=7.7Hz), 5.41(2H, brs), 4.54(2H, d, J=6.6Hz), 4.35-4.14(2H, m), 2.49-2.15(3H, m), 1.95-1.55(5H, m), 1.50-1.13(5H, m), 1.10-0.77(2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 568(M+1) | |

| | | |
|--------------|-----------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 176 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 8.24(1H, s), 7.97and7.87(2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69and7.19(4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.35(1H, t, J=8.1Hz), 6.81(1H, d, J=9.2Hz), 6.72(1H, s), 6.71(1H, d, J=6.5Hz), 4.48-4.20(2H, m), 3.95-3.75(3H, m), 3.03(1H, t, J=12.3Hz), 2.60-2.40(1H, m), 2.39-2.15(2H, m), 2.07-1.58(6H, m), 1.99(3H, s), 1.50-1.00(5H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 568(M+1) | |

| | | |
|--------------|-----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 177 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 12.76(1H, s), 8.23(1H, s), 7.96and7.86(2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69and7.20(4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.39(1H, t, J=8.2Hz), 6.86(1H, d, J=8.3Hz), 6.81(1H, s), 6.76(1H, d, J=8.0Hz), 4.83(2H, s), 4.31(1H, brt, J=12.2Hz), 2.39-2.19(2H, m), 1.99-1.79(4H, m), 1.70-1.58(1H, m), 1.48-1.20(3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 467(M+1) | |

表 50

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 178 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, s), 8.75 (1H, s), 8.63 (2H, d, J=3.8Hz), 8.25 (1H, s), 8.04-8.01 (2H, m), 8.02 and 7.90 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.72 and 7.20 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.57 (2H, dd, J=7.8, 5.0Hz), 7.40 (1H, t, J=8.2Hz), 6.93 (1H, d, J=8.2Hz), 6.87 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=8.2Hz), 5.23 (2H, s), 4.33 (1H, br t, J=12.2Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2.00-1.55 (5H, m), 1.50-1.15 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 520 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 179 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=9.0Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.58-7.32 (5H, m), 6.98 (1H, d, J=2.1Hz), 6.93 (1H, dd, J=8.7, 2.1Hz), 5.27 (2H, s), 4.16-4.00 (1H, m), 3.87 (3H, s), 2.20-2.12 (2H, m), 2.02-1.98 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.52-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 457 (M+1) | |

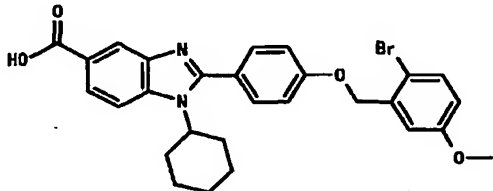
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 180 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.85 (1H, d, J=8.6Hz), 7.63 (2H, d, J=8.4Hz), 7.60 (1H, d, J=9.0Hz), 7.25 (2H, d, J=8.4Hz), 7.23 (1H, d, J=3.0Hz), 6.95 (1H, dd, J=9.0, 3.0Hz), 5.19 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.78 (3H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 2.00-1.87 (4H, m), 1.66 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 536 (M+1) | |

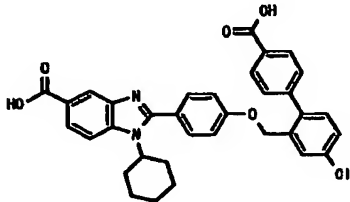
表 51

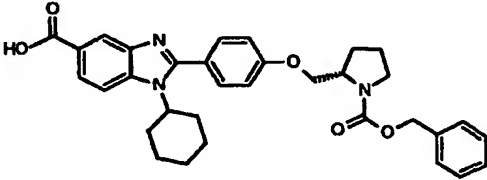
| | | |
|-------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 181 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.19 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.65 (4H, d, J=7.4Hz), 7.47 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44-7.27 (6H, m), 6.99 (2H, d, J=8.7Hz), 4.20 (1H, m), 2.34-2.12 (2H, m), 1.98-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.46-1.13 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 547 (M+) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 182 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.55 (1H, d, J=2.1Hz), 8.32 (1H, m), 8.21 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=7.8Hz), 7.68-7.56 (7H, m), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 5.21 (1H, s), 4.26 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.74-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 582 (M+) | |

| | | |
|-------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 183 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.16 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94-7.87 (2H, m), 7.71-7.62 (3H, m), 7.50-7.42 (4H, m), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.14 (2H, d, J=8.4Hz), 5.06 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 594 (M+) | |

表 52

| 実施例番号 | 184 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 13.2 (2H, brs), 8.30 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.8Hz), 8.04 (1H, d, J=8.8Hz), 8.00 (2H, d, J=8.2Hz), 7.79 (1H, s), 7.73 (2H, d, J=8.7Hz), 7.61-7.56 (3H, m), 7.44 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 5.13 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (1H, m), 1.75-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 581 (M+1) | |

| 実施例番号 | 185 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.30 (1H, m), 8.24 (1H, d, J=9.0Hz), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.79-7.10 (9H, m), 5.20-5.07 (2H, m), 4.43-4.04 (4H, m), 3.50-3.36 (2H, m), 2.40-1.19 (14H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 554 (M+1) | |

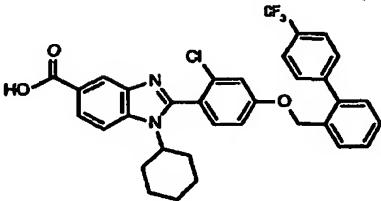
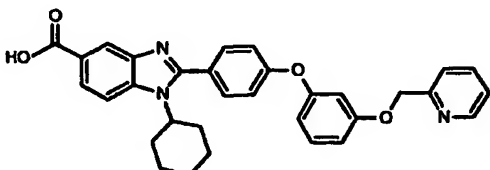
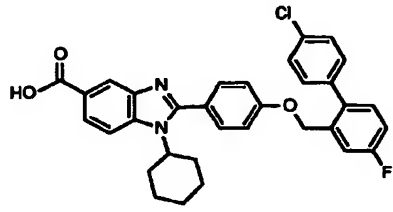
| 実施例番号 | 186 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | (DMSO-d ₆) δ : 8.29 (1H, brs), 8.10 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.79 (2H, d, J=8.4Hz), 7.74-7.67 (1H, m), 7.68 (2H, d, J=8.4Hz), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.57-7.50 (2H, m), 7.46-7.39 (1H, m), 7.29 (1H, d, J=2.4Hz), 7.11 (1H, dd, J=2.4, 8.4Hz), 5.12 (2H, s), 3.99-3.84 (1H, m), 2.35-1.72 (6H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.42-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 605 (M+1) | |

表 53

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 187 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.76 (1H, s), 8.57 (1H, d, J=4.4Hz), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.2Hz), 7.87-7.82 (1H, m), 7.68 and 7.12 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.53 (2H, d, J=7.8Hz), 7.37 (1H, t, J=8.3Hz), 7.36-7.33 (1H, m), 6.90 (1H, d, J=8.3Hz), 6.83 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.0Hz), 5.20 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.2Hz), 2.35-2.19 (2H, m), 1.99-1.57 (5H, m), 1.45-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 520 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 188 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.92 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.57 (2H, d, J=8.7Hz), 7.57-7.27 (7H, m), 7.11 (2H, d, J=8.7Hz), 5.07 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.36-2.16 (2H, m), 1.98-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.49-1.17 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 555 (M+1) | |

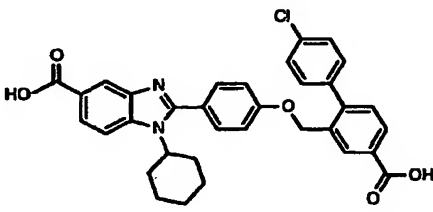
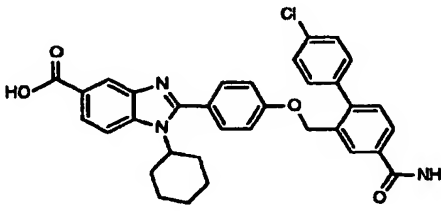
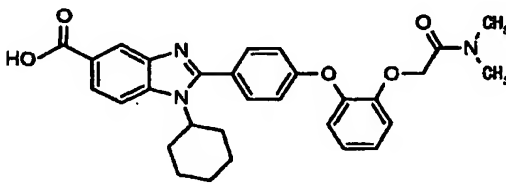
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 189 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.30-8.20 (2H, m), 8.10-7.98 (2H, m), 7.74 (2H, d, J=9.0Hz), 7.60-7.46 (5H, m), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.19 (2H, s), 4.44-4.30 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.12-1.78 (4H, m), 1.72-1.58 (4H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 581 (M+1) | |

表 54

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 190 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.36-7.90 (5H, m), 7.74 (2H, d, J=8.6Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.45-4.28 (1H, m), 2.40-2.15 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 580 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 191 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.00 (6H, m), 4.86 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.89 (3H, s), 2.80 (3H, s), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 514 (M+1) | |

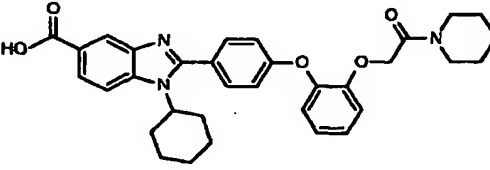
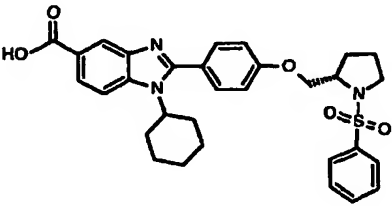
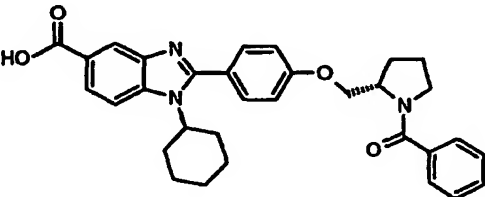
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 192 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.26-7.01 (6H, m), 4.84 (2H, s), 4.31 (1H, m), 3.36 (4H, m), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.15 (10H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 554 (M+1) | |

表 55

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 193 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.00 (1H, brs), 8.29 (1H, d, J=1.4Hz), 8.15 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.97 (1H, dd, J=1.4Hz, 8.8Hz), 7.89 (2H, d, J=8.8Hz), 7.80-7.60 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.8Hz), 4.47-3.90 (4H, m), 3.20-3.10 (2H, m), 2.41-1.22 (14H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 560 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 194 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.5Hz), 7.87 (1H, d, J=8.5Hz), 7.70-7.17 (9H, m), 4.60-4.13 (4H, m), 3.72-3.40 (2H, m), 2.40-1.15 (14H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 524 (M+1) | |

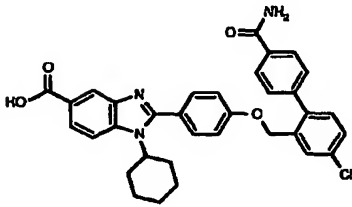
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 195 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.09-7.92 (5H, m), 7.77 (1H, s), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.59-7.51 (3H, m), 7.43 (2H, d, J=8.4Hz), 7.17 (2H, d, J=8.7Hz), 5.10 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.10 (3H, m). |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 580 (M+1) | |

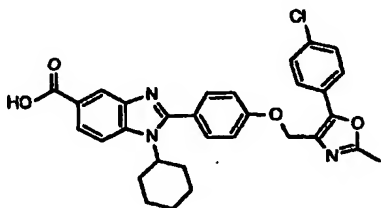
表 56

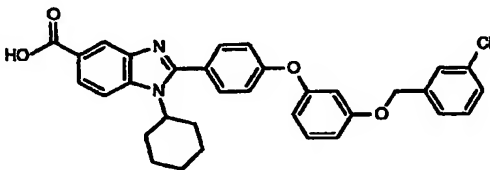
| | | |
|-------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 196 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=8.4Hz), 7.69 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.34 (1H, t, J=8.0Hz), 6.80-6.69 (3H, m), 4.83 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.98 (3H, s), 2.84 (3H, s), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 514 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 197 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=8.4Hz), 6.80-6.70 (3H, m), 4.82 (2H, s), 4.31 (1H, m), 3.40 (4H, m), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.15 (10H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 554 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 198 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=4.4Hz), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.36 (1H, t, J=7.8Hz), 6.82 (1H, d, J=9.3Hz), 6.73 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=7.2Hz), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=6.0Hz), 3.59 (2H, d, J=11.7Hz), 2.85 (3H, s), 2.73 (2H, t, J=10.5Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 1.98-1.59 (8H, m), 1.46-1.18 (5H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 604 (M+1) | |

表 57

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 199 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.30 (1H, d, J=8.9Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.39 (2H, d, J=8.8Hz), 5.28 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 542 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 200 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | (DMSO-d6) δ : 8.23 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.69 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (1H, s), 7.50-7.30 (4H, m), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.90 (1H, d, J=8.3Hz), 6.84 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.3Hz), 5.15 (2H, s), 4.39-4.21 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 1.99-1.80 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1) | |

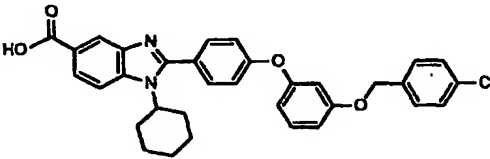
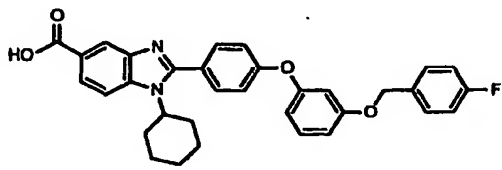
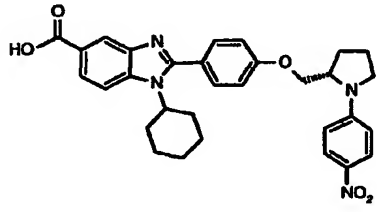
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 201 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | (DMSO-d6) δ : 8.26 (1H, s), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.47 (4H, s), 7.38 (1H, t, J=8.2Hz), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 6.90 (1H, d, J=8.2Hz), 6.83 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.2Hz), 5.14 (2H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 2.04-1.78 (4H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1) | |

表 58

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 202 | 1H NMR(δ) ppm (DMSO-d ₆) δ : 12.81 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (2H, d, J=8.6Hz), 7.53-7.47 (2H, m), 7.38 (1H, t, J=8.2Hz), 7.26-7.16 (4H, m), 6.89 (1H, d, J=8.2Hz), 6.82 (1H, s), 6.73 (1H, d, J=8.2Hz), 5.11 (2H, s), 4.40-4.21 (1H, m), 2.40-2.17 (2H, m), 2.01-1.77 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 537 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 203 | 1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 12.74 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 8.08 (2H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (2H, d, J=8.7Hz), 7.58 (2H, d, J=8.7Hz), 7.13 (2H, d, J=8.7Hz), 6.83 (2H, d, J=9.0Hz), 4.50-4.08 (4H, m), 3.68-3.30 (2H, m), 2.40-1.23 (14H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 541 (M+1) | |

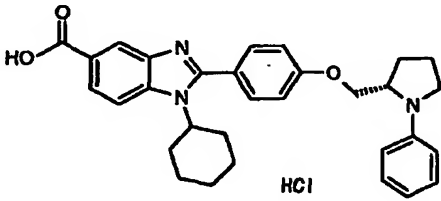
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 204 | 1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 8.39-8.28 (2H, m), 8.08 (1H, d, J=8.8Hz), 7.76 (2H, d, J=8.7Hz), 7.29 (2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.13 (2H, m), 6.80-6.60 (3H, m), 4.46-3.98 (4H, m), 3.51-3.42 (1H, m), 3.20-3.04 (1H, m), 2.39-1.20 (14H, m) |
|  | | |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | | |

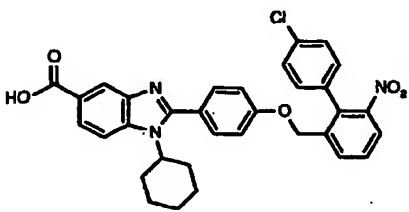
表 59

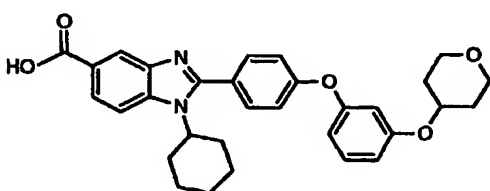
| | | |
|-------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 205 | $^1\text{H NMR}(\delta) \text{ ppm}$ 300MHz, DMSO-d ₆ 9.59(1H, brs), 8.23(1H, s), 8.04(1H, d, J=8.4Hz), 7.90(1H, d, J=8.4Hz), 7.62(2H, d, J=8.7Hz), 7.39(2H, 2H, d, J=8.7Hz) 7.18(2H, d, J=8.7Hz), 6.63(2H, d, J=8.7Hz), 3.95-3.37(4H, m), 3.51-3.40(1H, m), 3.17-3.02(1H, m), 2.39-1.18(17H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 206 | $^1\text{H NMR}(\delta) \text{ ppm}$ 300MHz, DMSO-d ₆ 13.1(1H, brs), 8.33(1H, s), 8.29(1H, d, J=8.8Hz), 8.06(1H, d, J=8.7Hz), 7.77(2H, d, J=8.7Hz), 7.59-7.52(4H, m), 7.35(2H, d, J=8.8Hz), 5.19(2H, s), 4.39(1H, m), 2.71(3H, s), 2.45-2.20(2H, m), 2.20-1.95(2H, m), 1.95-1.75(2H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.55-1.15(3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 558 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 207 | $^1\text{H NMR}(\delta) \text{ ppm}$ 300MHz, DMSO-d ₆ 8.29(1H, s), 8.26(1H, d, J=8.8Hz), 8.04(1H, d, J=8.7Hz), 7.73(2H, d, J=8.8Hz), 7.50-7.41(6H, m), 7.36(2H, d, J=8.8Hz), 7.18-7.13(2H, m), 6.84(1H, s), 4.33(1H, m), 2.40-2.15(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.95-1.75(2H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.55-1.15(3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 539 (M+1) | |

表 60

| 実施例番号 | 208 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.07-8.00 (3H, m), 7.79-7.70 (3H, m), 7.51 (2H, d, J=8.1Hz), 7.40 (2H, d, J=8.4Hz), 7.18 (2H, d, J=8.7Hz), 4.99 (2H, s), 4.34 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 582 (M+1) | |

| 実施例番号 | 209 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=4.4Hz), 7.98a and 7.88 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.70 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.4Hz), 7.35 (1H, t, J=8.4Hz), 6.86 (1H, d, J=8.1Hz), 6.79 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=8.1Hz), 4.65-4.53 (1H, m), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.88-3.78 (2H, m), 3.48 (2H, t, J=9.0Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 1.02-1.71 (6H, m), 1.70-1.50 (3H, m), 1.46-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 513 (M+1) | |

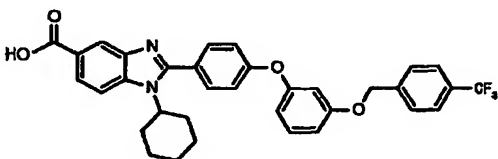
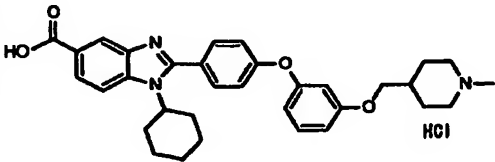
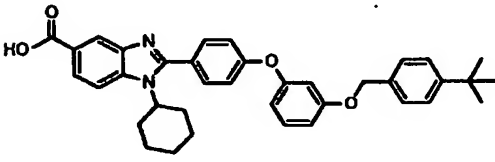
| 実施例番号 | 210 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.84-7.66 (6H, m), 7.38 (1H, t, J=8.4Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.91 (1H, d, J=9.0Hz), 6.84 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.1Hz), 5.26 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 1.99-1.76 (4H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 587 (M+1) | |

表 61

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 211 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.15 and 7.47 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 and 7.24 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.39 (1H, t, J=7.8Hz), 6.84 (1H, d, J=9.3Hz), 6.76 (1H, s), 6.75 (1H, d, J=9.5Hz), 4.36 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=6.0Hz), 3.42 (2H, d, J=10.8Hz), 3.04-2.88 (2H, m), 2.78-2.60 (1H, m), 2.71 (2H, d, J=4.8Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 2.07-1.80 (7H, m), 1.70-1.20 (5H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 540 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 212 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.68 and 7.17 (4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.43-7.33 (5H, m), 6.87 (1H, d, J=8.1Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.91 (1H, d, J=9.0Hz), 6.81 (1H, s), 6.72 (1H, d, J=8.0Hz), 5.08 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.20 (2H, m), 1.98-1.78 (4H, m), 1.69-1.60 (1H, m), 1.41-1.21 (3H, m), 1.28 (9H, s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 575 (M+1) | |

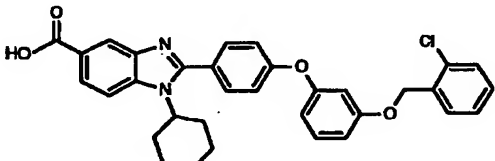
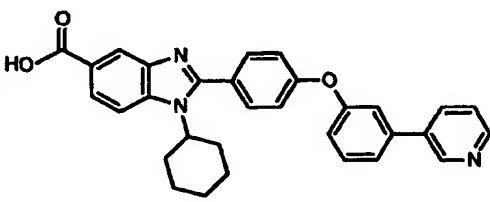
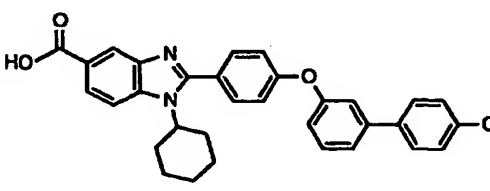
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 213 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.4Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.7Hz), 7.62-7.36 (5H, m), 6.90 (1H, d, J=8.1Hz), 6.84 (1H, s), 6.76 (1H, d, J=8.1Hz), 5.19 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.76 (4H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1) | |

表 62

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 214 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.94 (1H, d, J=2.1Hz), 8.60 (1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 8.12 (1H, dt, J=8.1, 2.1Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.70 (1H, d, J=8.7Hz), 7.67-7.54 (3H, m), 7.50 (1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 7.21 (1H, m), 4.31 (1H, m), 2.38-2.19 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.48-1.22 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 490 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 215 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73 (2H, d, J=8.4Hz), 7.71 (2H, d, J=8.4Hz), 7.63-7.39 (2H, m), 7.52 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 7.18 (1H, m), 4.31 (1H, m), 2.39-2.20 (2H, m), 2.00-1.76 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 523 (M+1) | |

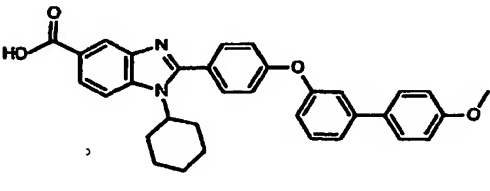
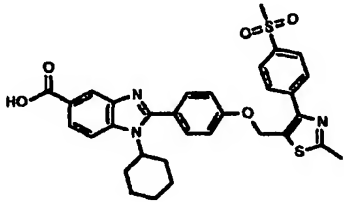
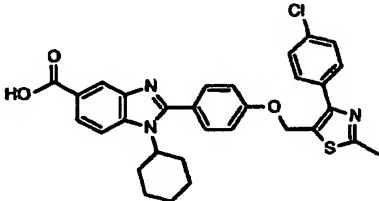
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 216 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=1.4Hz), 7.95 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.64 (2H, d, J=8.8Hz), 7.56-7.48 (2H, m), 7.40 (1H, s), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 7.10 (1H, m), 7.03 (2H, d, J=8.8Hz), 4.31 (1H, m), 3.80 (3H, s), 2.48-2.20 (2H, m), 2.00-1.88 (4H, m), 1.66 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 519 (M+1) | |

表 63

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 217 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | (DMSO-d6) δ : 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.96 (3H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.63 (2H, d, J=8.6Hz), 7.25 (2H, d, J=8.6Hz), 5.50 (2H, s), 4.36-4.21 (1H, m), 3.27 (3H, s), 2.74 (3H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 602 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 218 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.9 (1H, brs), 8.25 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.72 (2H, d, J=8.5Hz), 7.67 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56 (2H, d, J=8.5Hz), 7.26 (2H, d, J=8.7Hz), 5.45 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.71 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 558 (M+1) | |

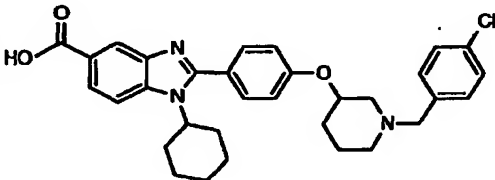
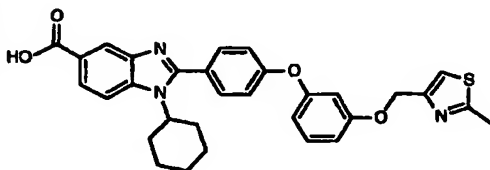
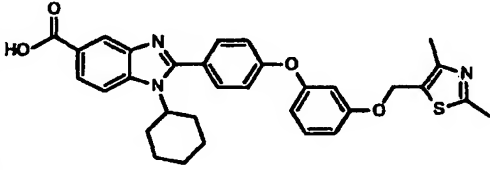
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 219 | 1H NMR(δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.93 (1H, d, J=9.0Hz), 7.84 (1H, dd, J=9.0, 1.5Hz), 7.56 (2H, d, J=8.7Hz), 7.42-7.30 (4H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 4.53 (1H, brs), 4.36-4.20 (1H, m), 3.55 (2H, brs), 3.00-2.90 (1H, m), 2.70-2.58 (1H, m), 2.40-1.10 (18H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 544 (M+1) | |

表 64

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 220 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.76 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=8.9 Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.55 (1H, s), 7.37 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.85 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=7.5 Hz), 5.13 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.65 (3H, s), 2.41-2.20 (2H, m), 2.00-1.74 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.58-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 540 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 221 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.7 Hz), 7.37 (1H, t, J=8.2 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.82 (1H, s), 6.75 (1H, d, J=8.0 Hz), 5.24 (2H, s), 4.32 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.58 (3H, s), 2.38-2.20 (2H, m), 2.30 (3H, s), 2.00-1.79 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.44-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 554 (M+1) | |

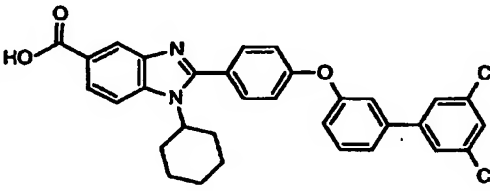
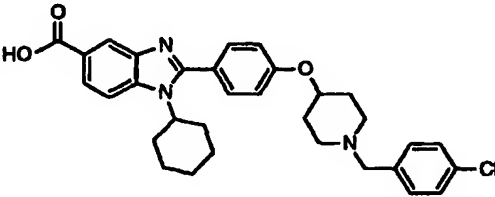
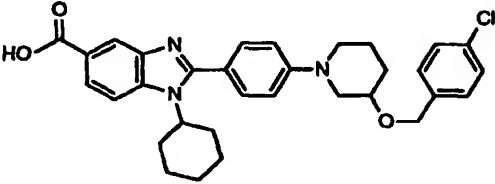
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 222 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.88 (1H, brs), 8.25 (s, 1H), 8.07-7.57 (11H, m), 7.26 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.24 (1H, m), 4.34 (1H, m), 2.30-2.20 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 557 (M+1) | |

表 65

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 223 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 10.96 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.84 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.76-7.40 (7H, m), 7.18 (2H, d, J=8.0Hz), 4.24-4.16 (2H, m), 2.40-1.12 (18H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 544 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 224 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | (DMSO-d6) δ : 8.22 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.4Hz), 7.92 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40 (2H, d, J=8.4Hz), 7.30 (2H, d, J=8.4Hz), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 4.61 (2H, s), 4.48-4.32 (1H, m), 3.82 (1H, brd, J=12.3Hz), 3.65-3.47 (2H, m), 3.10 (brdd, J=8.4, 12.3Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.09-1.76 (6H, m), 1.71-1.16 (6H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 544 (M+1) | |

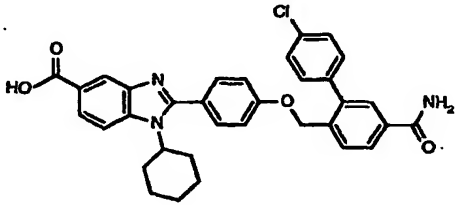
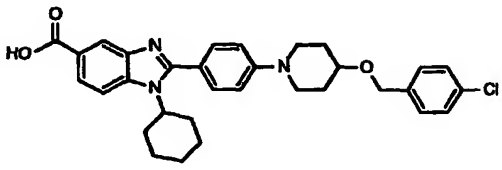
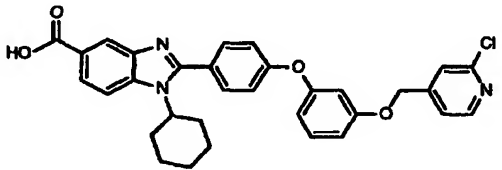
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 225 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | (DMSO-d6) δ : 12.83 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 8.10 (1H, brs), 7.01-7.91 (2H, m), 7.89-7.82 (2H, m), 7.75 (1H, d, J=8.0Hz), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.53 (4H, s), 7.46 (1H, brs), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (2H, s), 4.35-4.17 (1H, m), 2.38-2.20 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.48-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 580 (M+1) | |

表 66

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 226 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 and 8.08 (2H, ABq, J=8.7 Hz), 8.31 (1H, m), 7.66 and 7.26 (4H, A'B'q, J=9.2 Hz), 7.42 and 7.39 (4H, A''B''q, J=8.7 Hz), 4.57 (2H, s), 4.50 (1H, br t, J=12.2 Hz), 3.85-3.62 (3H, m), 3.28-3.16 (2H, m), 2.42-2.23 (2H, m), 2.14-1.81 (6H, m), 1.72-1.25 (6H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 544 (M+1) | |

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 227 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.43 (1H, d, J=5.0 Hz), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.57 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.40 (2H, t, J=8.2 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=7.9 Hz), 5.25 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.2 Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.75 (4H, m), 1.73-1.57 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 554 (M+1) | |

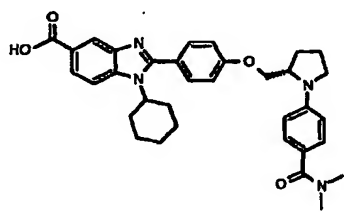
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 228 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.60 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.32 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.17 (2H, d, J=8.7 Hz), 6.70 (2H, d, J=8.7 Hz), 4.35-3.97 (4H, m), 3.62-3.11 (2H, m), 2.96 (6H, s), 2.39-1.12 (4H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 567 (M+1) | |

表 67

| | | |
|-------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 229 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.04 (1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.92 (1H, d, J=8.1Hz), 7.84 (1H, d, J=9.9Hz), 7.62-7.50 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (2H, q, J=6.9Hz), 4.30-4.20 (1H, m), 2.38-2.18 (2H, m), 1.98-1.18 (8H, m), 1.35 (3H, t, J=6.9Hz) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 608 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 230 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.35 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz), 7.87 (2H, d, J=8.7Hz), 7.74 (1H, t, J=8.1Hz), 7.64 (1H, d, J=7.8Hz), 7.59-7.50 (2H, m), 7.36 (2H, d, J=8.7Hz), 4.39 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m). |
| 純度 | 約 90% (NMR) | |
| MS | 481 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 231 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz DMSO-d6 12.78 (1H, brs), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.75 (2H, d, J=8.4Hz), 7.63 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 5.47 (2H, s), 4.29 (1H, m), 2.97 (6H, brs), 2.72 (3H, s), 2.39-2.16 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.49-1.17 (3H, m). |
| 純度 | 約 90% (NMR) | |
| MS | 595 (M+1) | |

表 68

| | | |
|-------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 232 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.70 (1H, s), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.53-7.50 (5H, m), 7.42 (1H, d, J=7.9Hz), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.27 (1H, m), 3.01 (3H, brs), 2.97 (3H, brs), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 608 (M+1) | |

| | | |
|-------|---------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 233 | 1H NMR (δ) ppm DMSO-d ₆ 13.20 (1H, brs), 8.99 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.8Hz), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.79-7.74 (4H, m), 7.60 (2H, d, J=8.5Hz), 7.30 (2H, d, J=8.7Hz), 5.26 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.72 (3H, s), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 553 (M+1-HCl) | |

| | | |
|-------|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 234 | 1H NMR (δ) ppm DMSO-d ₆ 8.77 (1H, d, J=3.6Hz), 8.36-8.26 (3H, m), 8.08 (1H, d, J=8.8Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.72-7.64 (3H, m), 7.58 (2H, d, J=8.4Hz), 7.30 (2H, d, J=8.7Hz), 5.26 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m). |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 538 (M+1-2HCl) | |

表 69

| | | |
|-------|-------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 235 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.74 (1H, brs), 8.67 (1H, dd, J=3.1, 1.6Hz), 8.21 (1H, d, J=1.6Hz), 7.93 (1H, d, J=8.6Hz), 7.90-7.80 (2H, m), 7.60-7.50 (7H, m), 7.09 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.60 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | APCI-MS 538 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 236 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d-6 8.40-7.40 (11H, m), 2.95, 2.81 (3H, each d, J=4.7Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | APCI-MS 555 (M+1) | |

| | | |
|-------|------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 237 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=9.5Hz), 8.02 (1H, s), 8.00-7.80 (3H, m), 7.70-7.50 (6H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.28 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | FAB-MS 605 (M+1) | |

表 70

| | | |
|-------|-------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 238 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.54 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 and 7.88 (2H, Abq, J=8.6Hz), 7.76 (2H, d, J=8.6Hz), 7.53-7.31 (3H, m), 6.61 (1H, s), 5.46 (2H, s), 4.32 (1H, brt), 2.40-2.20 (2H, m), 2.02-1.79 (4H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.48-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | APCI-MS 521 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 239 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.79 (1H, brs), 8.60 (2H, d, J=1.5Hz), 8.53 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 and 7.85 (2H, AB q, J=9.4Hz), 7.76 (2H, d, J=9.0Hz), 7.44 (4H, d, J=6.5Hz), 6.69 (1H, s), 5.53 (2H, s), 4.32 (1H, brt), 2.40-2.19 (2H, m), 2.03-1.82 (4H, m), 1.72-1.61 (1H, m), 1.42-1.22 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | APCI-MS 522 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 240 | 1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.90 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.3Hz), 8.05 (1H, d, J=8.8Hz), 7.96 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8.8Hz), 7.83 (1H, d, J=8.4Hz), 7.68-7.59 (2H, m), 7.54 (2H, d, J=8.8Hz), 4.37 (1H, brt), 2.30 (2H, m), 2.00 (2H, m), 1.88 (2H, m), 1.67 (1H, m), 1.5-1.2 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | APCI-MS 525 (M+1) | |

表71

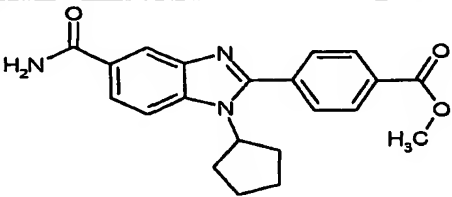
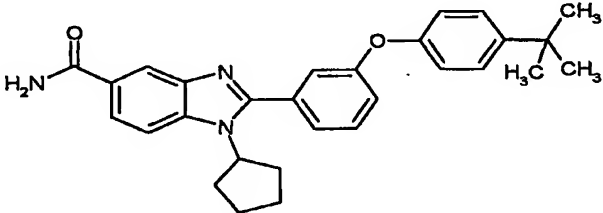
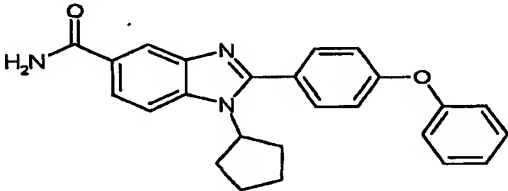
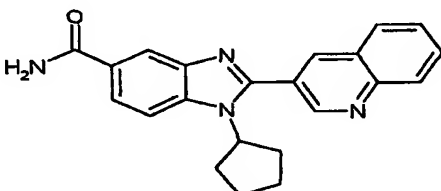
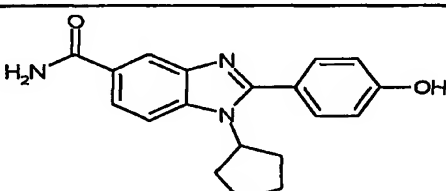
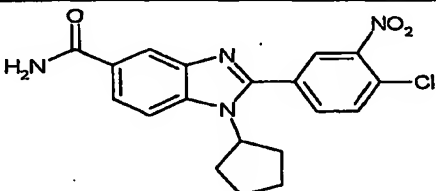
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1001 |  | 364(M+H) |
| 1002 |  | 454(M+H) |
| 1003 |  | 398(M+H) |
| 1004 |  | 357(M+H) |
| 1005 |  | 322(M+H) |
| 1006 |  | 385(M+H) |

表72

| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---|----------|
| 1007 | | 357(M+H) |
| 1008 | | 416(M+H) |
| 1009 | | 310(M+H) |
| 1010 | | 390(M+H) |
| 1011 | | 395(M+H) |
| 1012 | | 366(M+H) |

表73

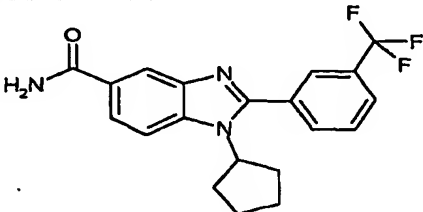
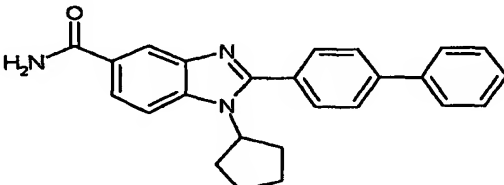
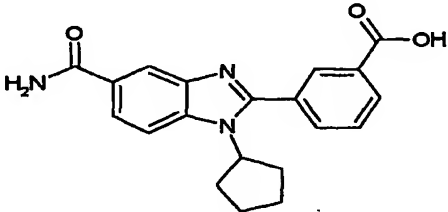
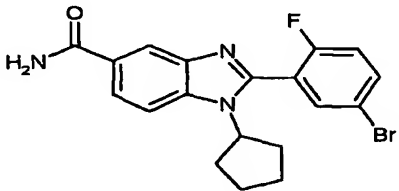
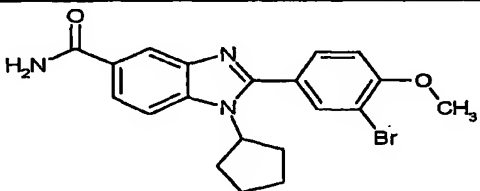
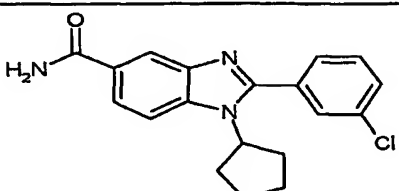
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1013 |  | 374(M+H) |
| 1014 |  | 382(M+H) |
| 1015 |  | 350(M+H) |
| 1016 |  | 402(M+H) |
| 1017 |  | 414(M+H) |
| 1018 |  | 340(M+H) |

表74

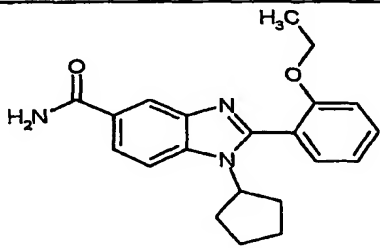
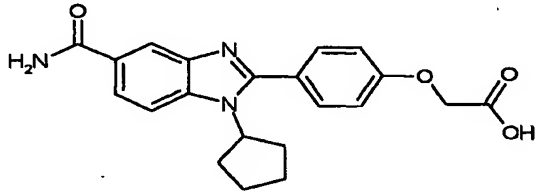
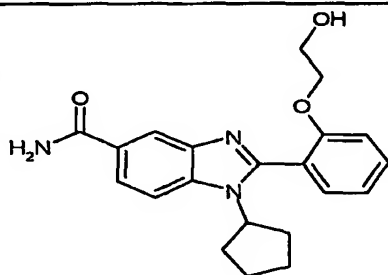
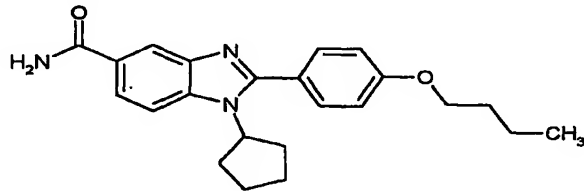
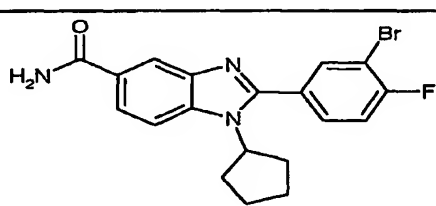
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1019 |  | 350(M+H) |
| 1020 |  | 380(M+H) |
| 1021 |  | 366(M+H) |
| 1022 |  | 378(M+H) |
| 1023 |  | 402(M+H) |

表75

| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---|----------|
| 1024 | | 518(M+H) |
| 1025 | | 408(M+H) |
| 1026 | | 336(M+H) |
| 1027 | | 408(M+H) |
| 1028 | | 366(M+H) |
| 1029 | | 362(M+H) |

表76

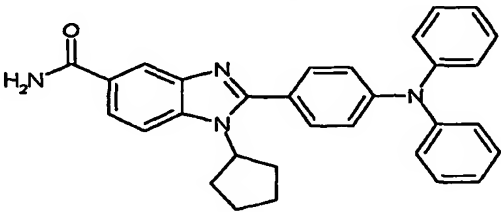
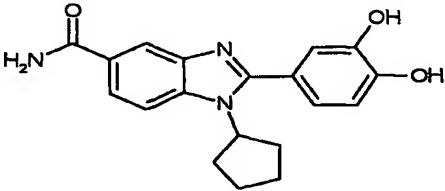
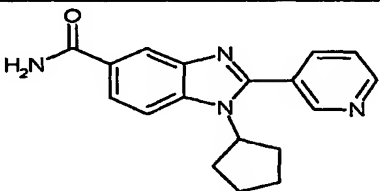
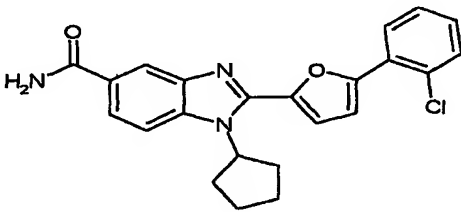
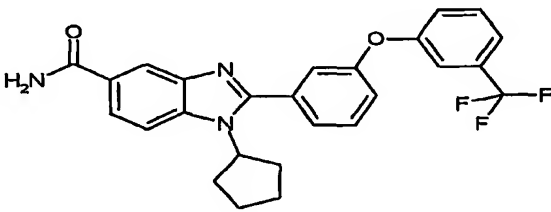
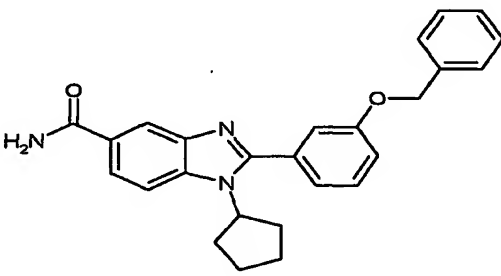
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1030 |  | 473(M+H) |
| 1031 |  | 338(M+H) |
| 1032 |  | 307(M+H) |
| 1033 |  | 406(M+H) |
| 1034 |  | 466(M+H) |
| 1035 |  | 412(M+H) |

表77

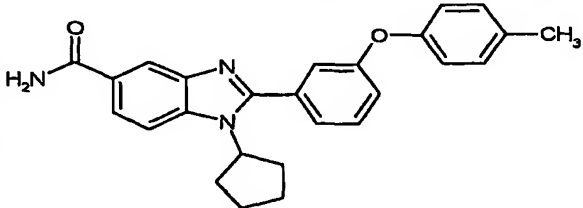
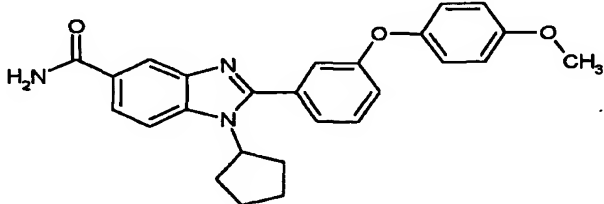
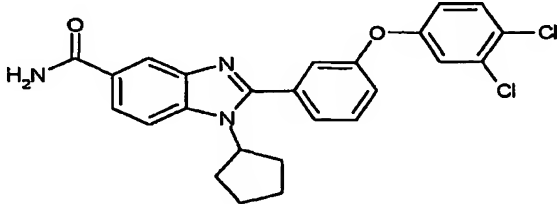
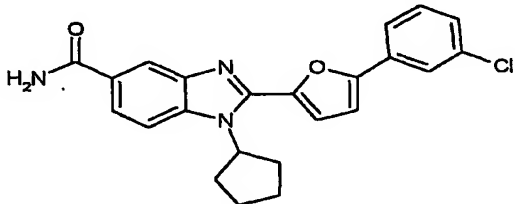
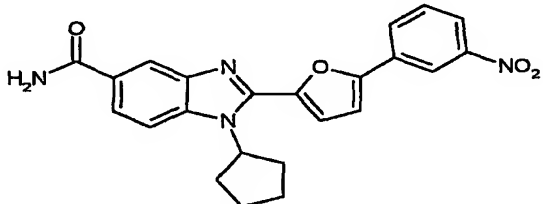
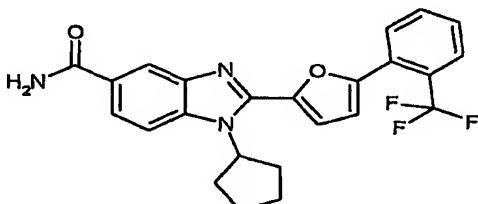
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1036 |  | 412(M+H) |
| 1037 |  | 428(M+H) |
| 1038 |  | 466(M+H) |
| 1039 |  | 406(M+H) |
| 1040 |  | 417(M+H) |
| 1041 |  | 440(M+H) |

表78

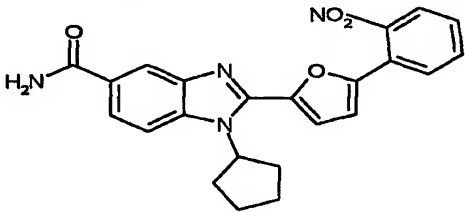
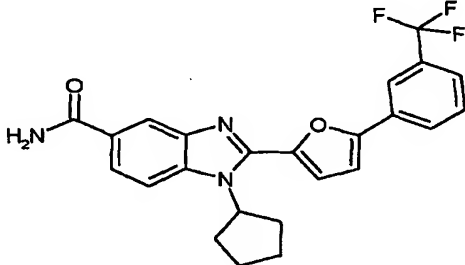
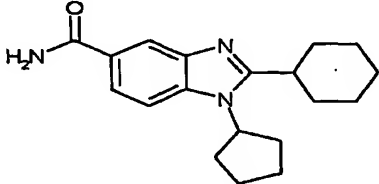
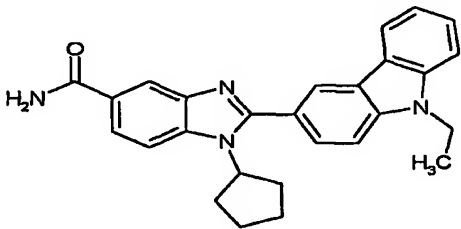
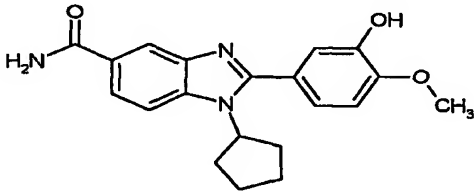
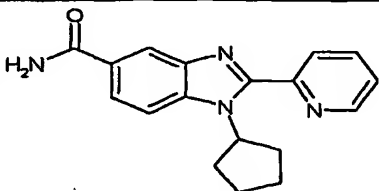
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1042 |  | 417(M+H) |
| 1043 |  | 440(M+H) |
| 1044 |  | 312(M+H) |
| 1045 |  | 423(M+H) |
| 1046 |  | 352(M+H) |
| 1047 |  | 307(M+H) |

表79

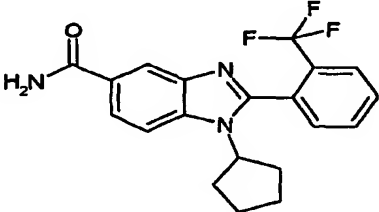
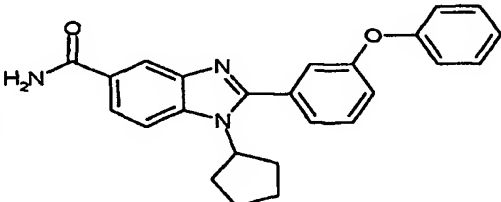
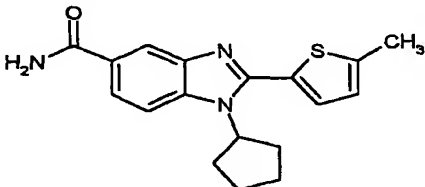
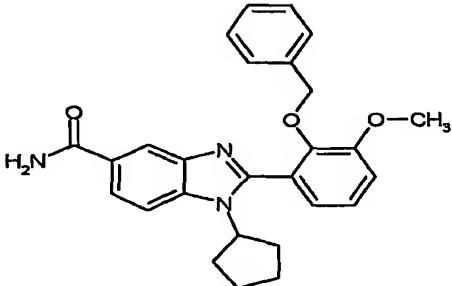
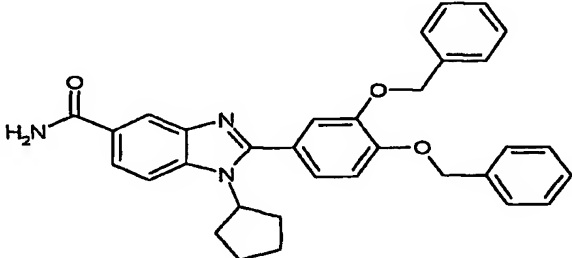
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1048 |  | 374(M+H) |
| 1049 |  | 398(M+H) |
| 1050 |  | 326(M+H) |
| 1051 |  | 442(M+H) |
| 1052 |  | 518(M+H) |

表80

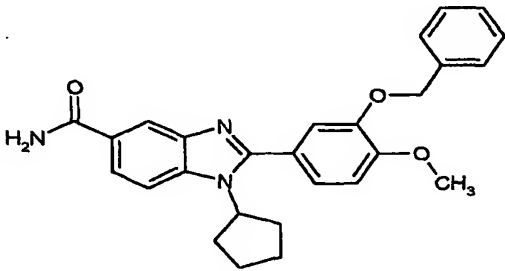
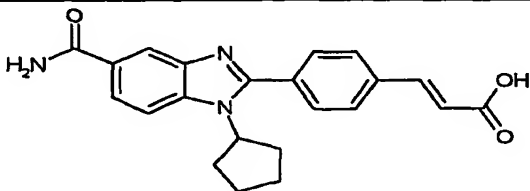
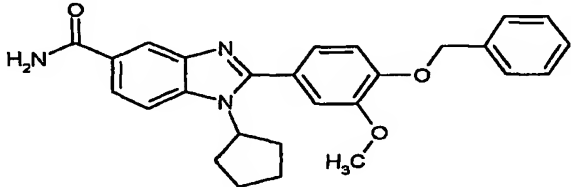
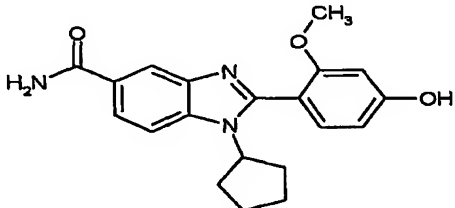
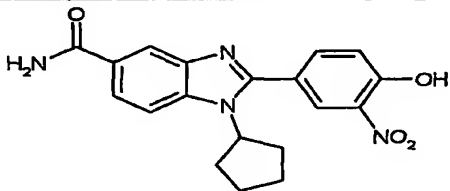
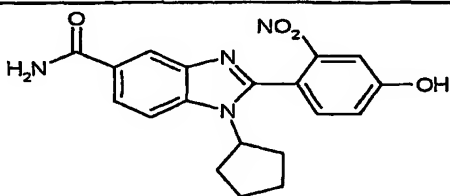
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1053 |  | 442(M+H) |
| 1054 |  | 376(M+H) |
| 1055 |  | 442(M+H) |
| 1056 |  | 352(M+H) |
| 1057 |  | 367(M+H) |
| 1058 |  | 367(M+H) |

表81

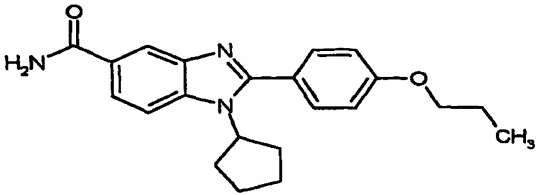
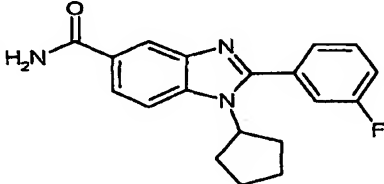
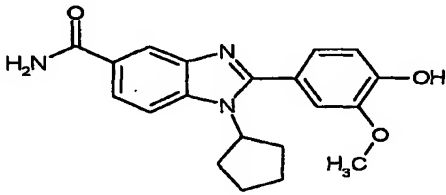
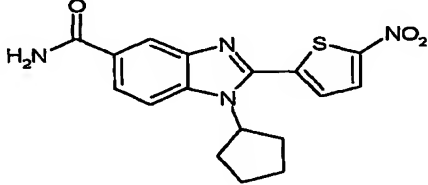
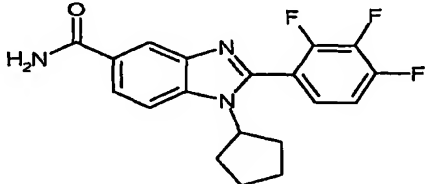
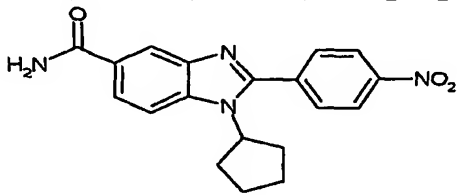
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1059 |  | 364(M+H) |
| 1060 |  | 324(M+H) |
| 1061 |  | 352(M+H) |
| 1062 |  | 357(M+H) |
| 1063 |  | 360(M+H) |
| 1064 |  | 351(M+H) |

表82

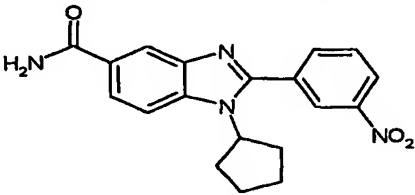
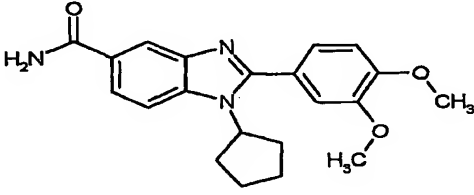
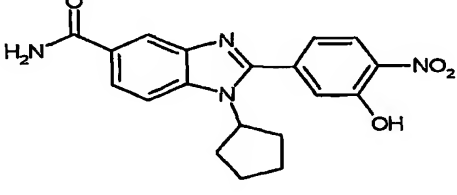
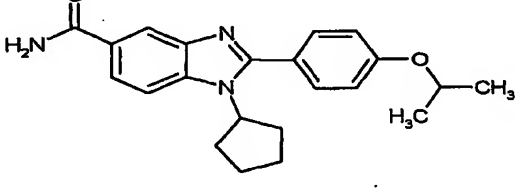
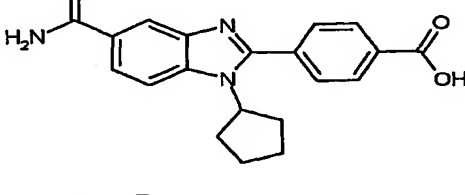
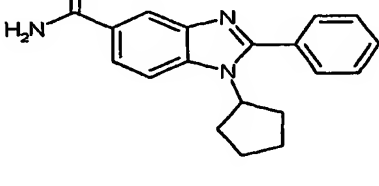
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1065 |  | 351(M+H) |
| 1066 |  | 366(M+H) |
| 1067 |  | 367(M+H) |
| 1068 |  | 364(M+H) |
| 1069 |  | 350(M+H) |
| 1070 |  | 306(M+H) |

表83

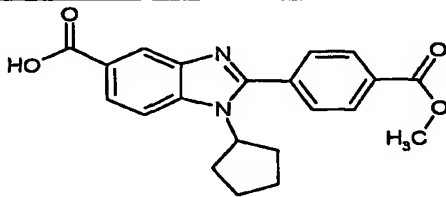
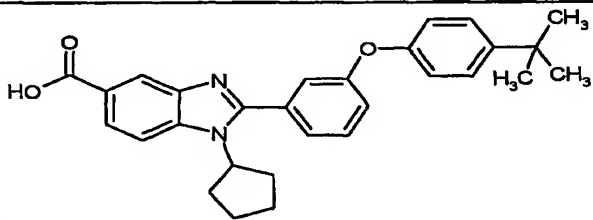
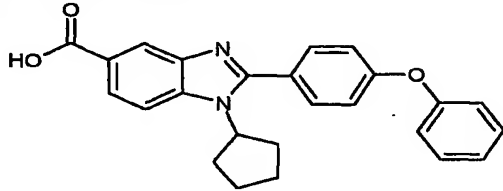
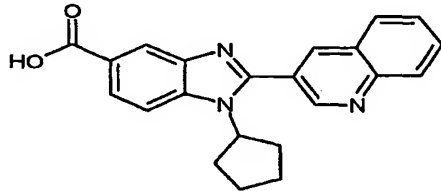
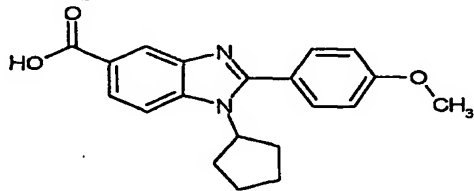
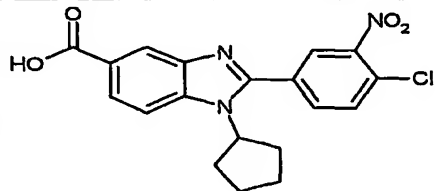
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1071 |  | 365(M+H) |
| 1072 |  | 455(M+H) |
| 1073 |  | 399(M+H) |
| 1074 |  | 358(M+H) |
| 1075 |  | 337(M+H) |
| 1076 |  | 386(M+H) |

表84

| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---|----------|
| 1077 | | 358(M+H) |
| 1078 | | 417(M+H) |
| 1079 | | 311(M+H) |
| 1080 | | 391(M+H) |
| 1081 | | 396(M+H) |
| 1082 | | 367(M+H) |

表85

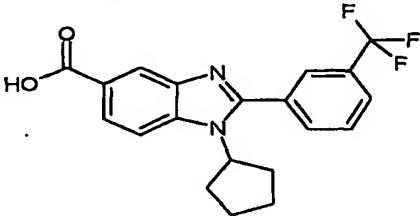
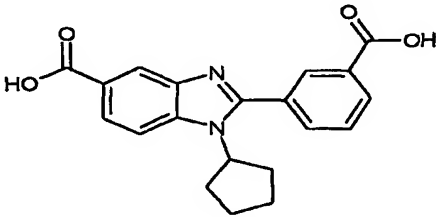
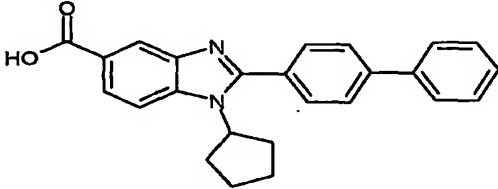
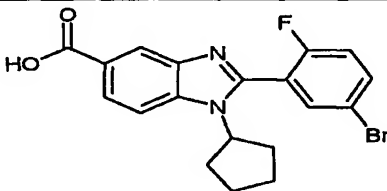
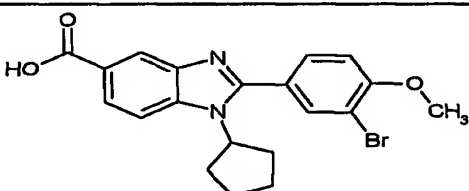
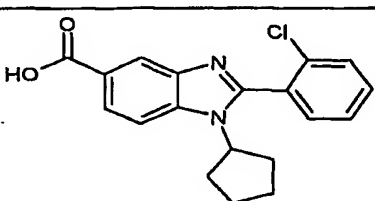
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1083 |  | 375(M+H) |
| 1084 |  | 351(M+H) |
| 1085 |  | 383(M+H) |
| 1086 |  | 403(M+H) |
| 1087 |  | 415(M+H) |
| 1088 |  | 341(M+H) |

表86

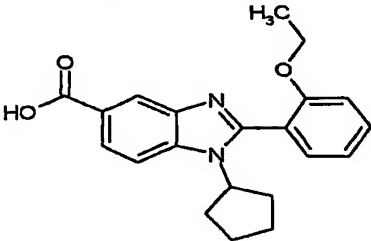
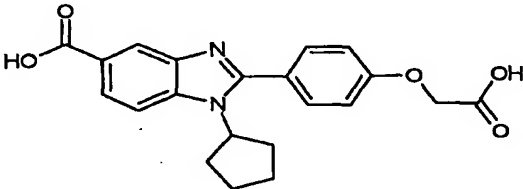
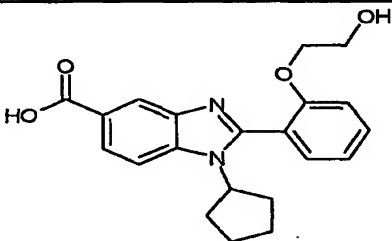
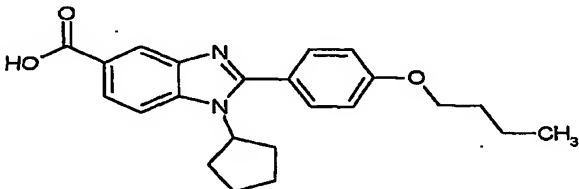
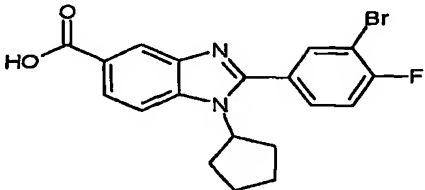
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1089 |  | 351(M+H) |
| 1090 |  | 381(M+H) |
| 1091 |  | 367(M+H) |
| 1092 |  | 379(M+H) |
| 1093 |  | 403(M+H) |

表87

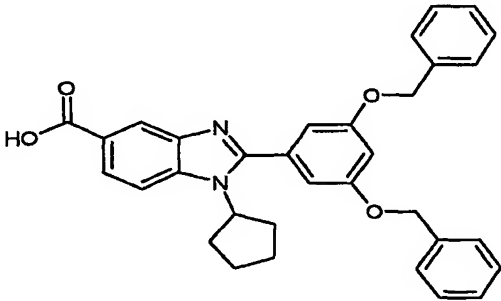
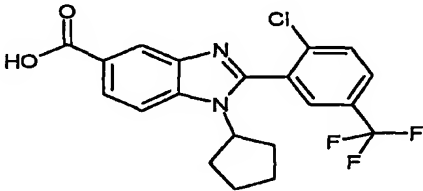
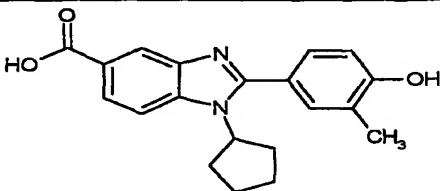
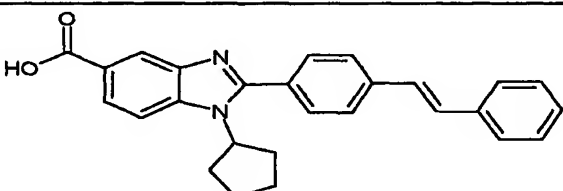
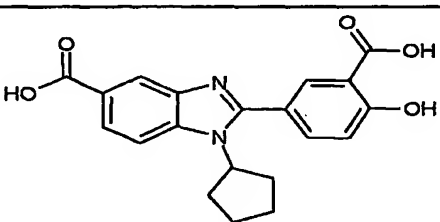
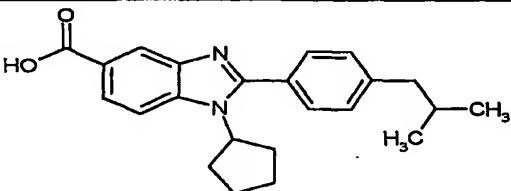
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1094 |  | 519(M+H) |
| 1095 |  | 409(M+H) |
| 1096 |  | 337(M+H) |
| 1097 |  | 409(M+H) |
| 1098 |  | 367(M+H) |
| 1099 |  | 363(M+H) |

表88

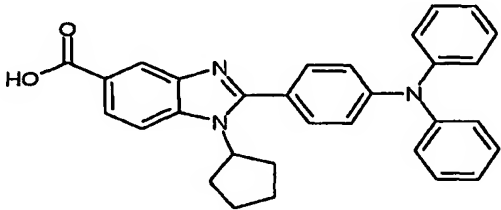
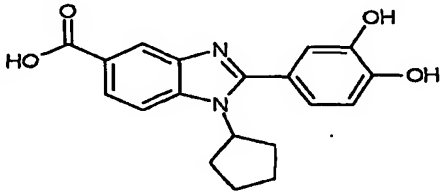
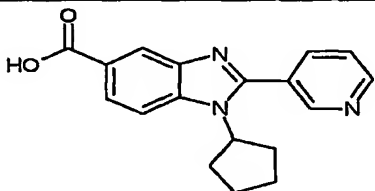
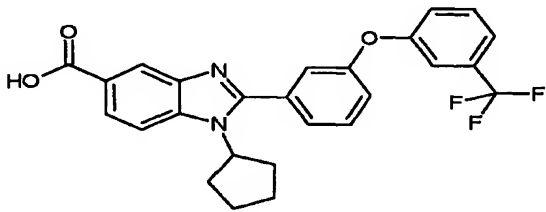
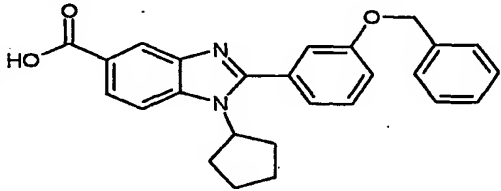
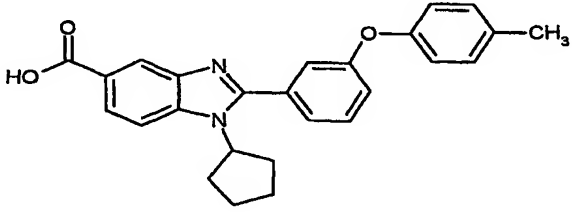
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1100 |  | 474(M+H) |
| 1101 |  | 339(M+H) |
| 1102 |  | 308(M+H) |
| 1103 |  | 467(M+H) |
| 1104 |  | 413(M+H) |
| 1105 |  | 413(M+H) |

表89

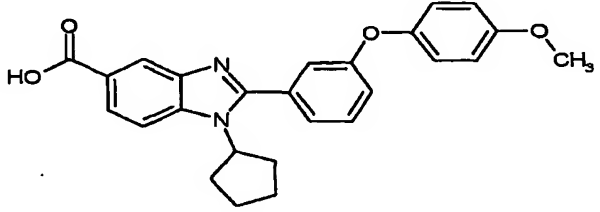
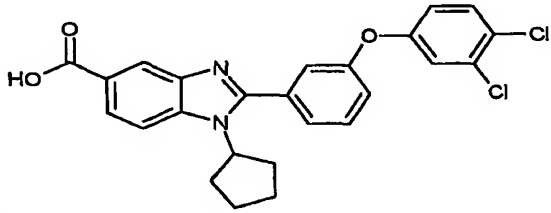
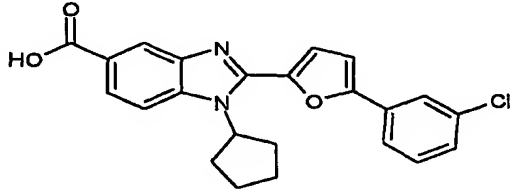
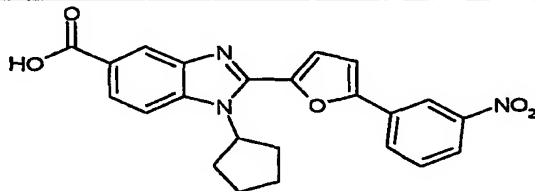
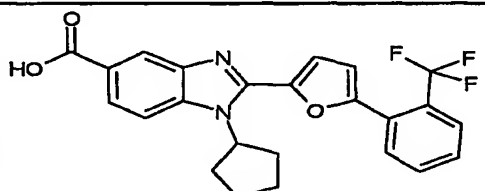
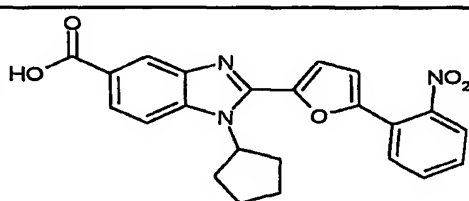
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1106 |  | 429(M+H) |
| 1107 |  | 467(M+H) |
| 1108 |  | |
| 1109 |  | |
| 1110 |  | 441(M+H) |
| 1111 |  | 418(M+H) |

表90

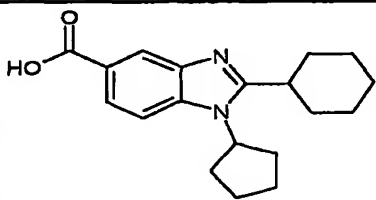
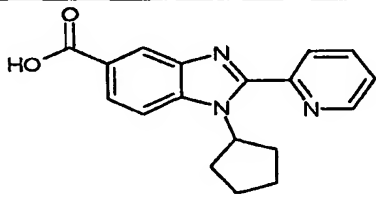
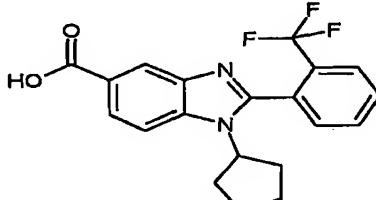
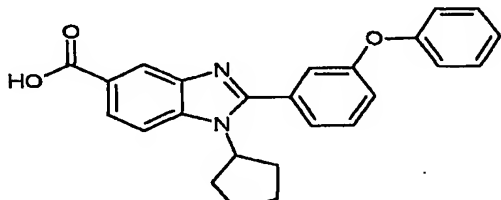
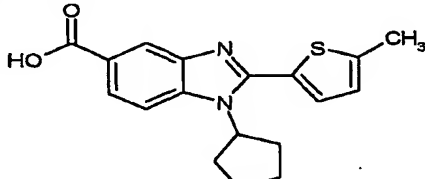
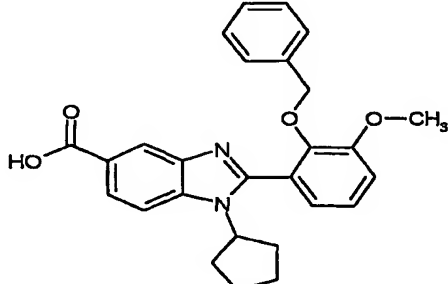
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1112 |  | 313(M+H) |
| 1113 |  | 308(M+H) |
| 1114 |  | 375(M+H) |
| 1115 |  | 399(M+H) |
| 1116 |  | 327(M+H) |
| 1117 |  | 443(M+H) |

表91

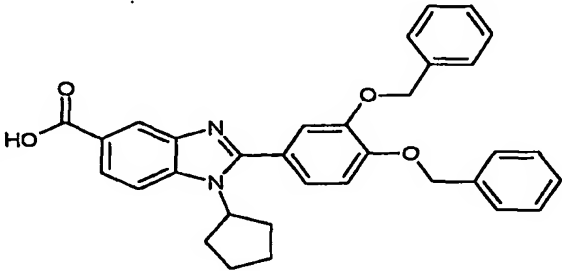
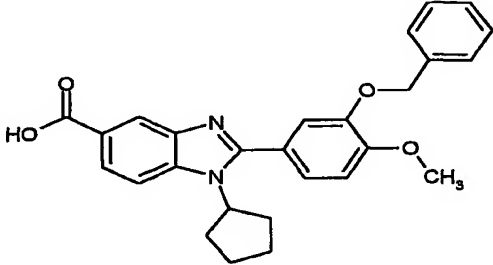
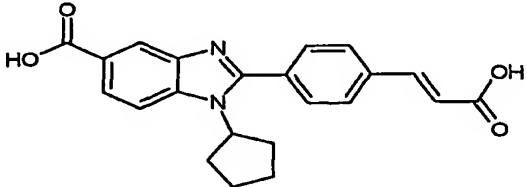
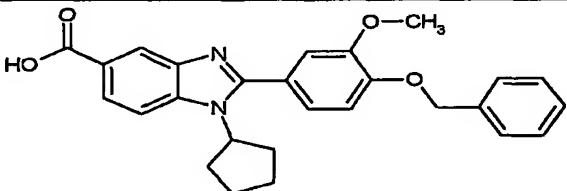
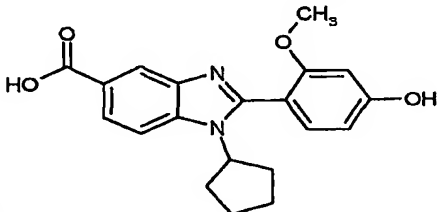
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1118 |  | 519(M+H) |
| 1119 |  | 443(M+H) |
| 1120 |  | 377(M+H) |
| 1121 |  | 443(M+H) |
| 1122 |  | 353(M+H) |

表92

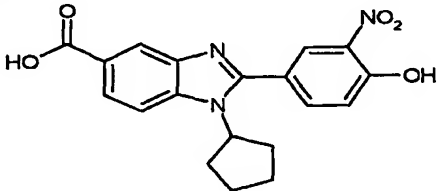
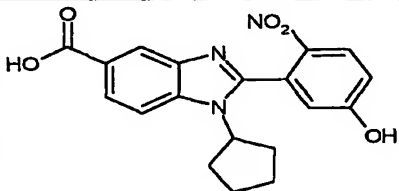
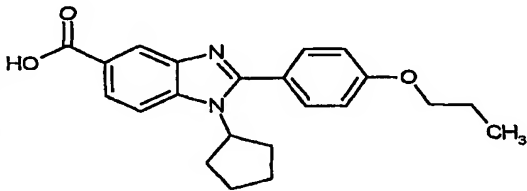
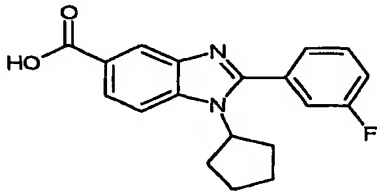
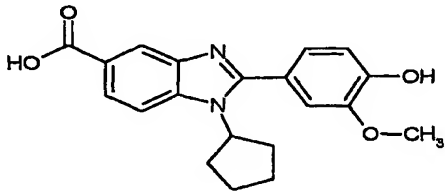
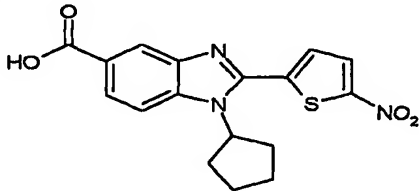
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1123 |  | 368(M+H) |
| 1124 |  | 368(M+H) |
| 1125 |  | 365(M+H) |
| 1126 |  | 325(M+H) |
| 1127 |  | 353(M+H) |
| 1128 |  | 358(M+H) |

表93

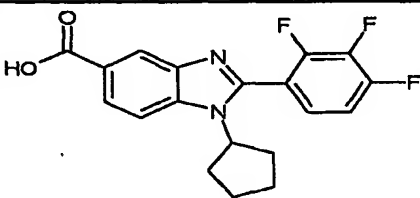
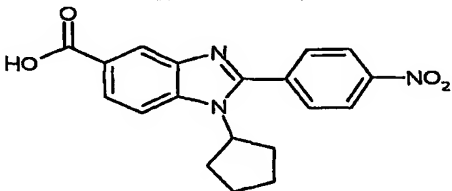
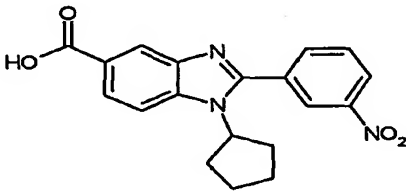
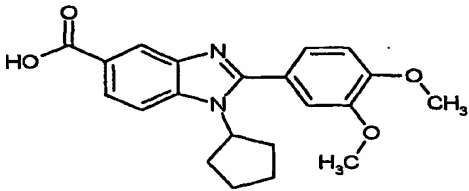
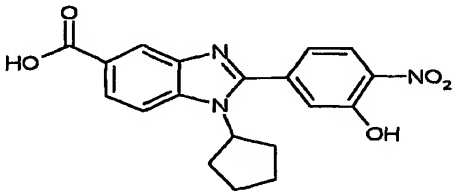
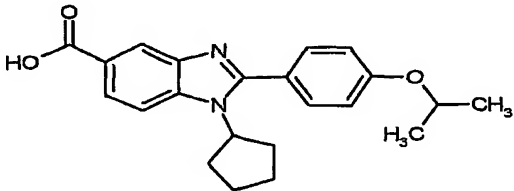
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1129 |  | 361(M+H) |
| 1130 |  | 352(M+H) |
| 1131 |  | 352(M+H) |
| 1132 |  | 367(M+H) |
| 1133 |  | 368(M+H) |
| 1134 |  | 365(M+H) |

表94

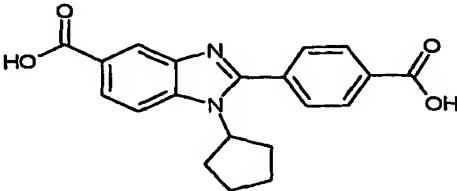
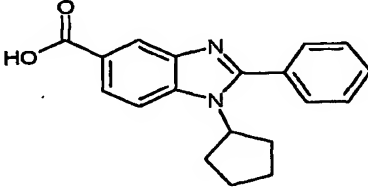
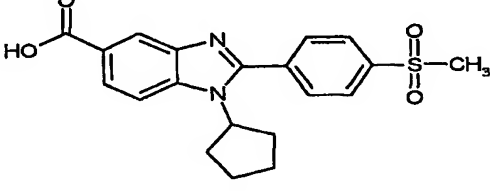
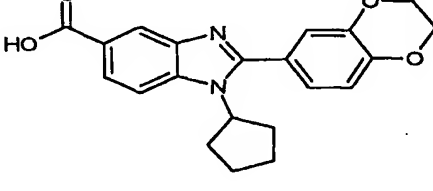
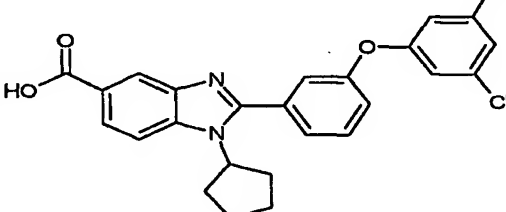
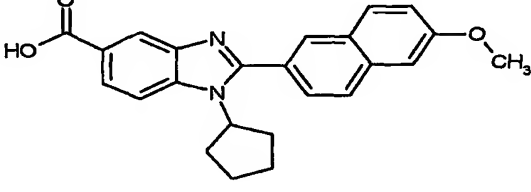
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1135 |  | 351(M+H) |
| 1136 |  | 307(M+H) |
| 1137 |  | 385(M+H) |
| 1138 |  | 365(M+H) |
| 1139 |  | 467(M+H) |
| 1140 |  | 387(M+H) |

表95

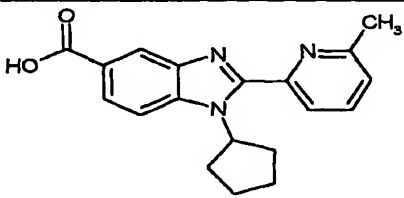
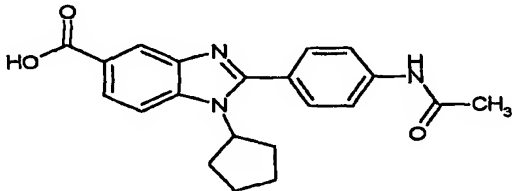
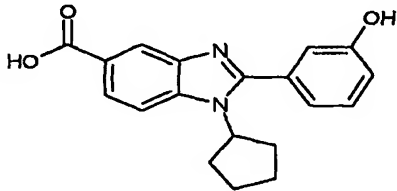
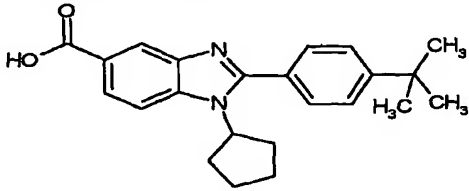
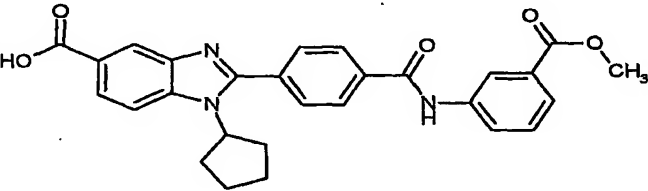
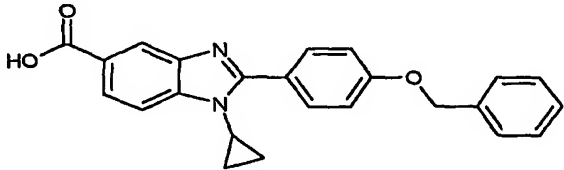
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1141 |  | 322(M+H) |
| 1142 |  | 364(M+H) |
| 1143 |  | 323(M+H) |
| 1144 |  | 363(M+H) |
| 1145 |  | 484(M+H) |
| 1146 |  | 385(M+H) |

表96

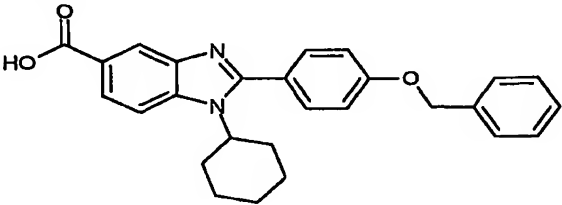
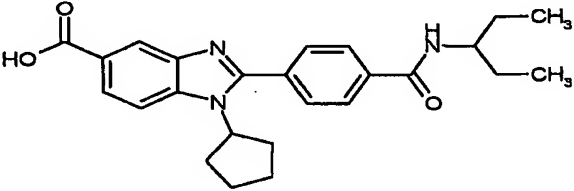
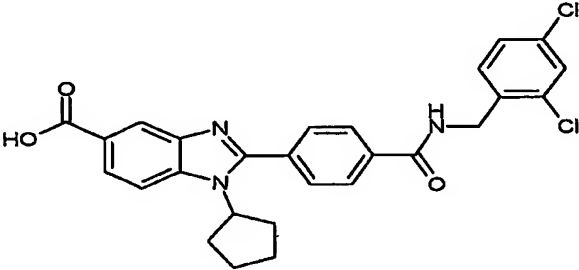
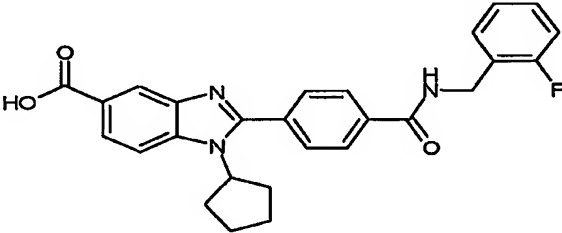
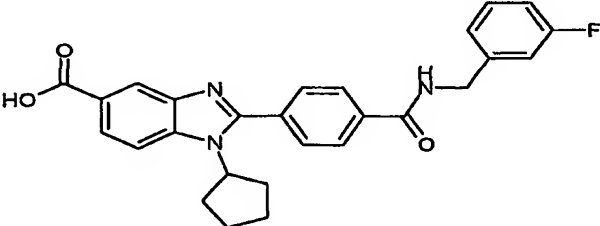
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1147 |  | 427(M+H) |
| 1148 |  | 420(M+H) |
| 1149 |  | 508(M+H) |
| 1150 |  | 458(M+H) |
| 1151 |  | 458(M+H) |

表97

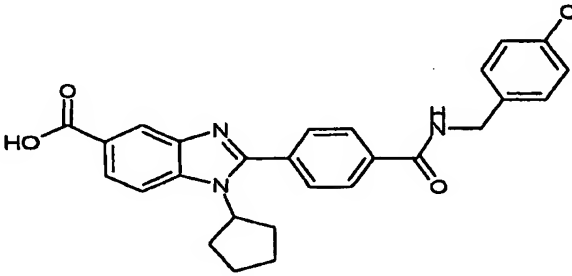
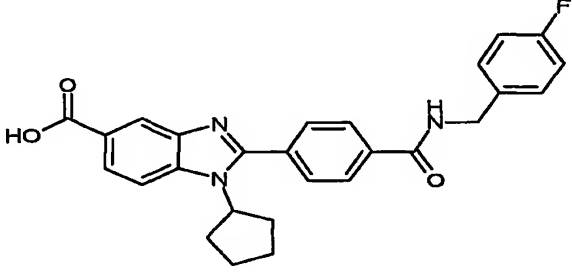
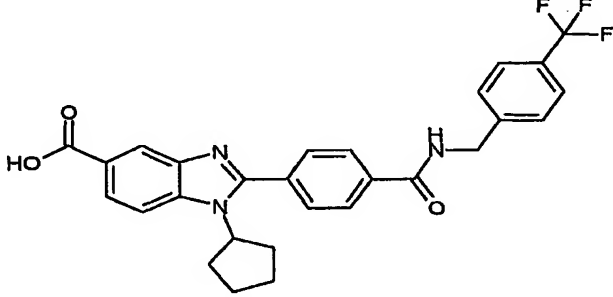
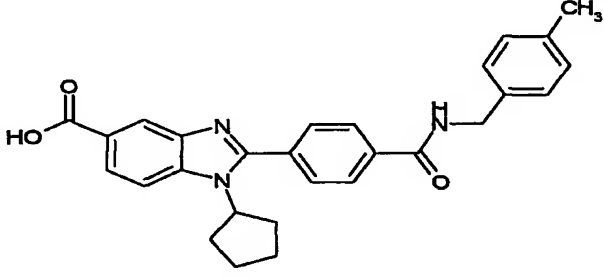
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1152 |  | 474(M+H) |
| 1153 |  | 458(M+H) |
| 1154 |  | 508(M+H) |
| 1155 |  | 454(M+H) |

表98

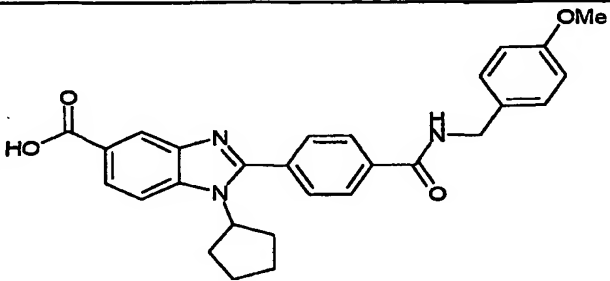
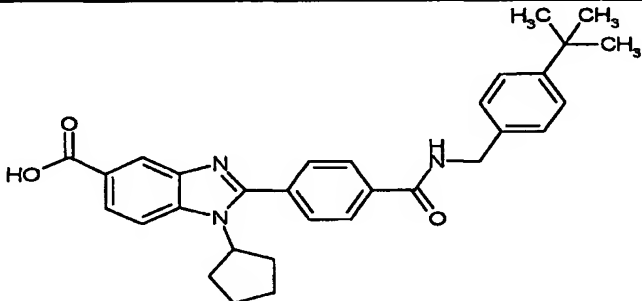
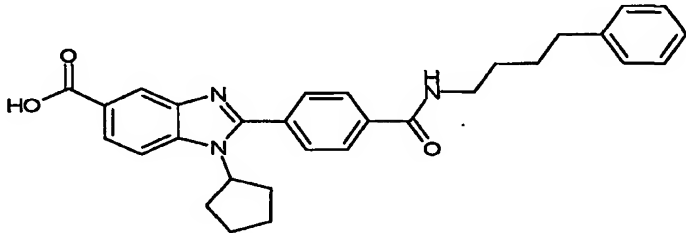
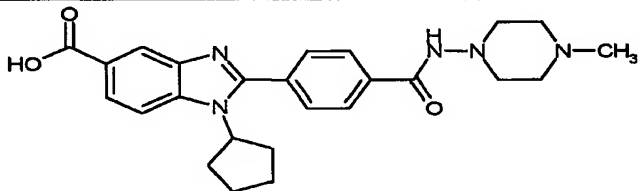
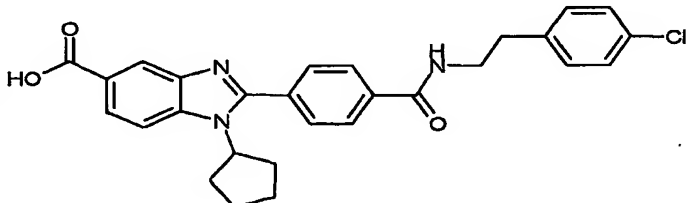
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1156 |  | 470(M+H) |
| 1157 |  | 496(M+H) |
| 1158 |  | 482(M+H) |
| 1159 |  | 448(M+H) |
| 1160 |  | 488(M+H) |

表99
式

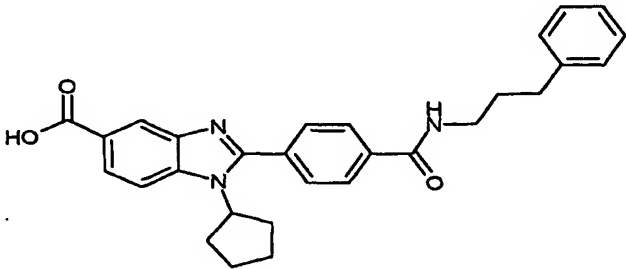
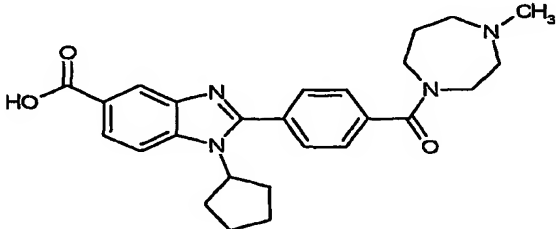
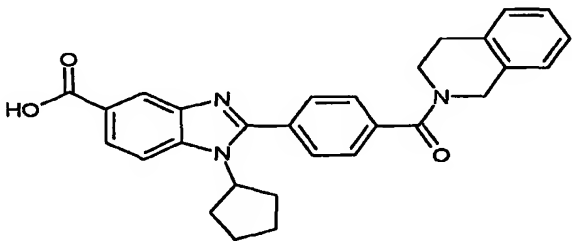
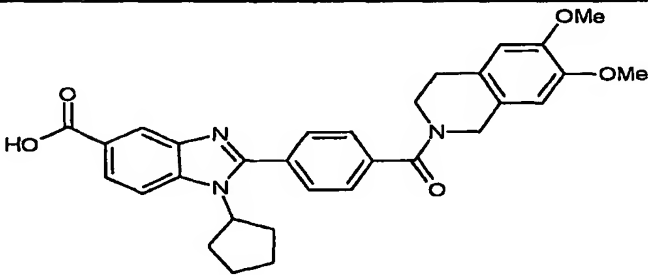
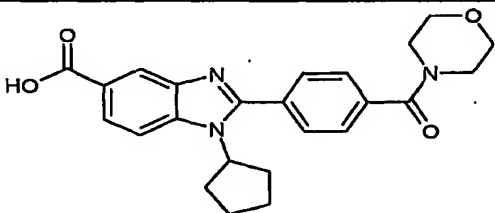
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1161 |  | 468(M+H) |
| 1162 |  | 447(M+H) |
| 1163 |  | 466(M+H) |
| 1164 |  | 526(M+H) |
| 1165 |  | 420(M+H) |

表100

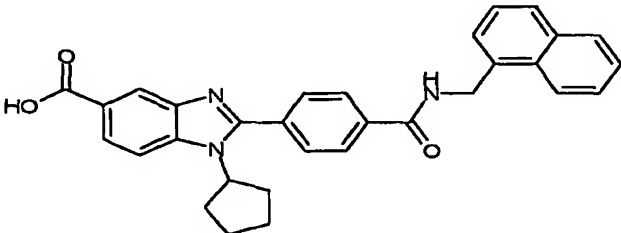
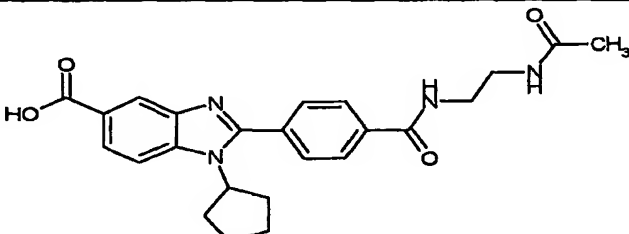
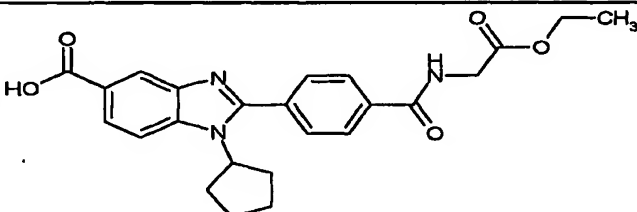
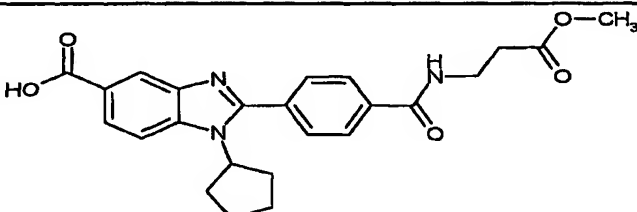
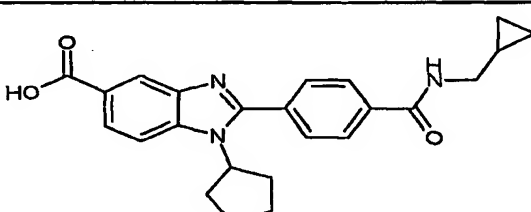
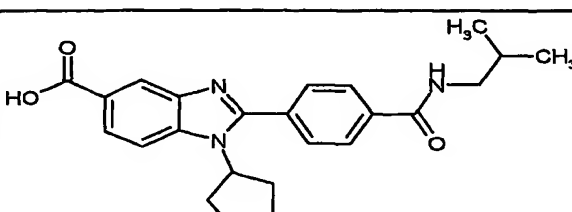
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1166 |  | 490(M+H) |
| 1167 |  | 435(M+H) |
| 1168 |  | 436(M+H) |
| 1169 |  | 436(M+H) |
| 1170 |  | 404(M+H) |
| 1171 |  | 406(M+H) |

表101

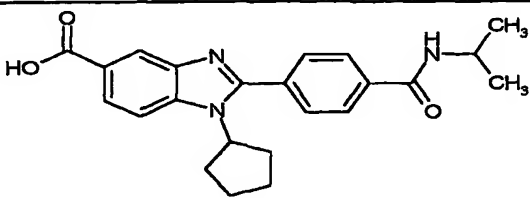
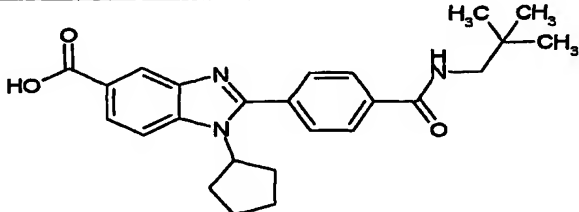
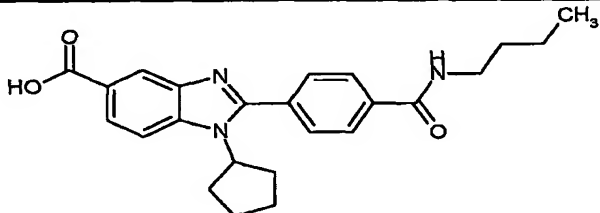
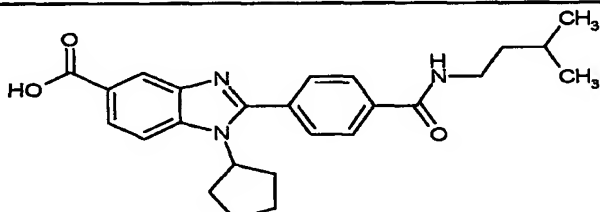
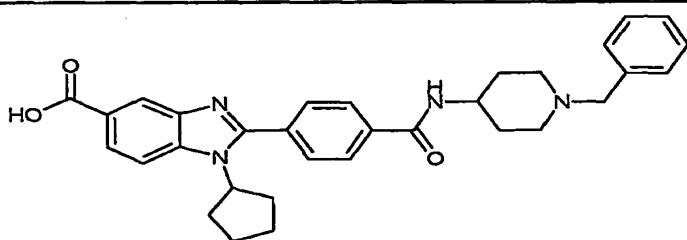
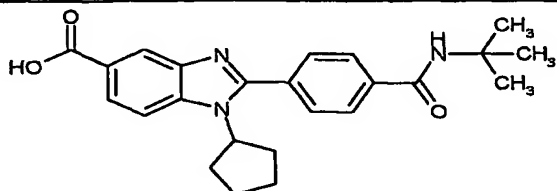
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1172 |  | 392(M+H) |
| 1173 |  | 420(M+H) |
| 1174 |  | 406(M+H) |
| 1175 |  | 420(M+H) |
| 1176 |  | 523(M+H) |
| 1177 |  | 406(M+H) |

表102

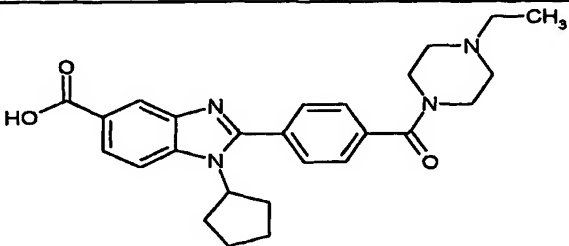
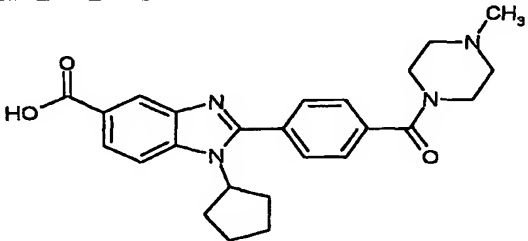
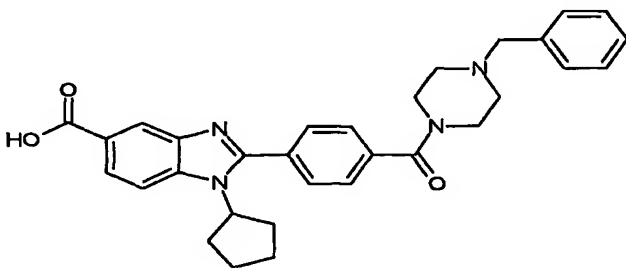
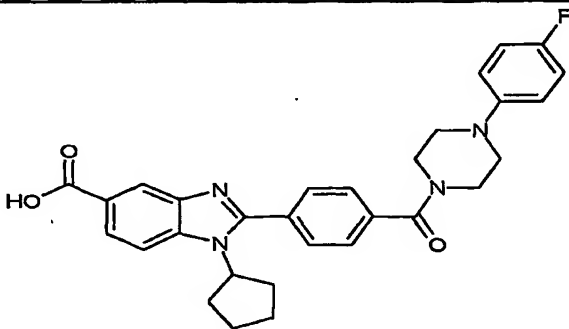
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1178 |  | 447(M+H) |
| 1179 |  | 433(M+H) |
| 1180 |  | 509(M+H) |
| 1181 |  | 513(M+H) |

表103

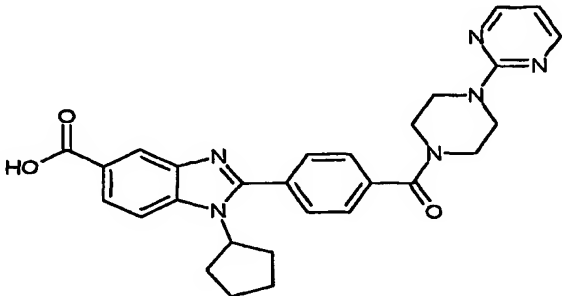
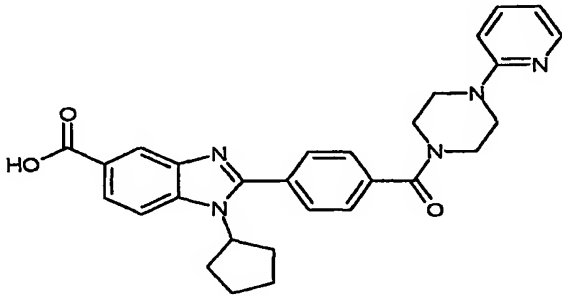
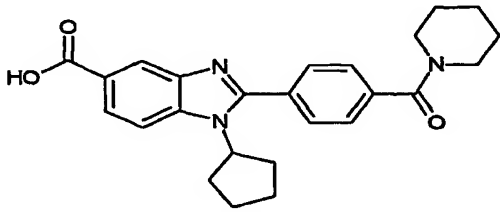
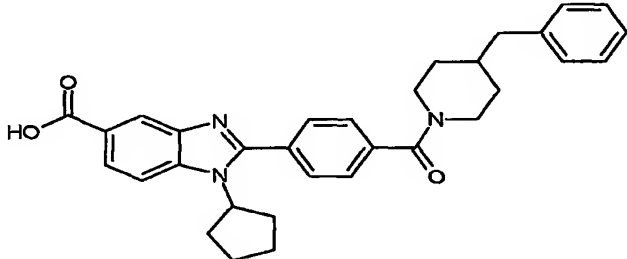
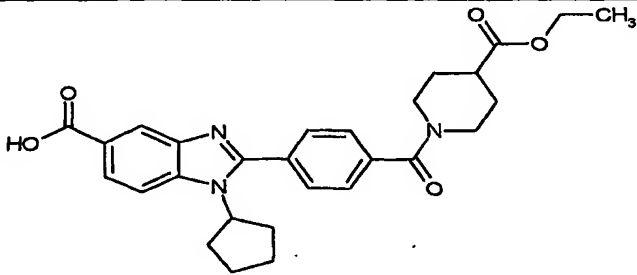
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1182 |  | 497(M+H) |
| 1183 |  | 496(M+H) |
| 1184 |  | 418(M+H) |
| 1185 |  | 508(M+H) |
| 1186 |  | 490(M+H) |

表104

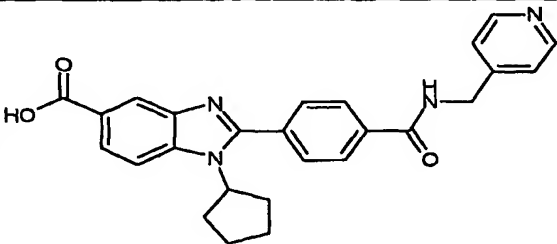
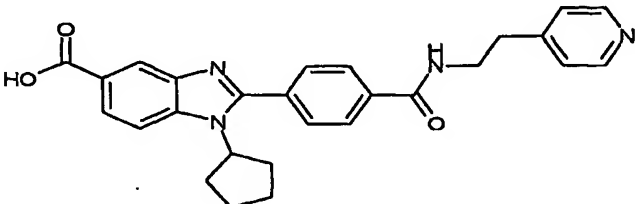
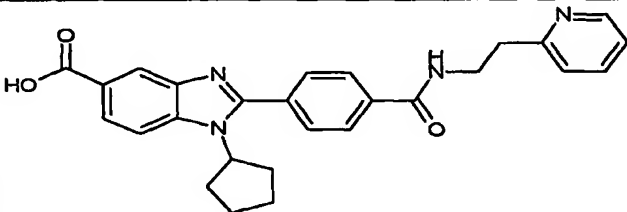
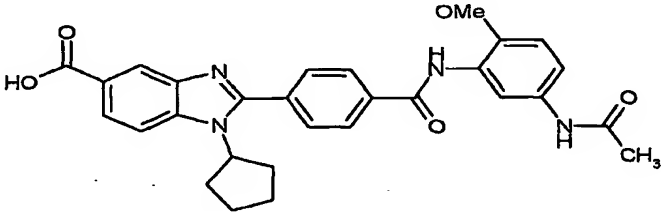
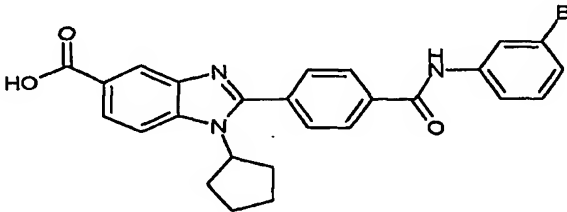
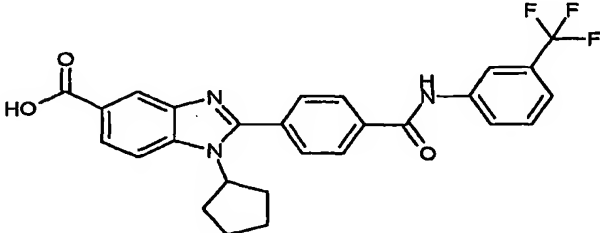
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1187 |  | 441(M+H) |
| 1188 |  | 455(M+H) |
| 1189 |  | 455(M+H) |
| 1190 |  | 513(M+H) |
| 1191 |  | 504(M+H) |
| 1192 |  | 494(M+H) |

表105

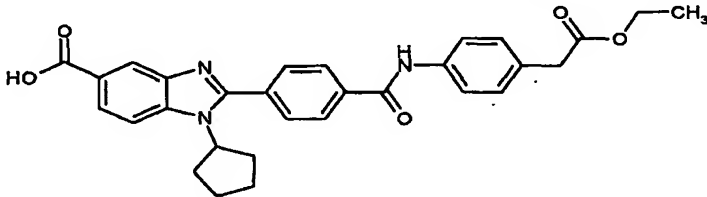
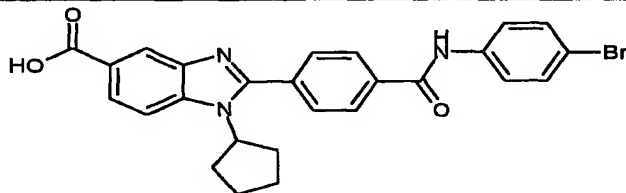
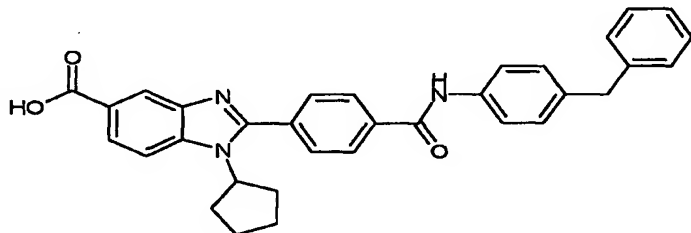
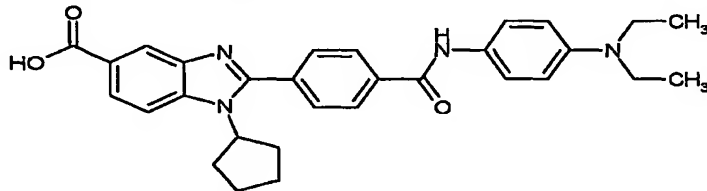
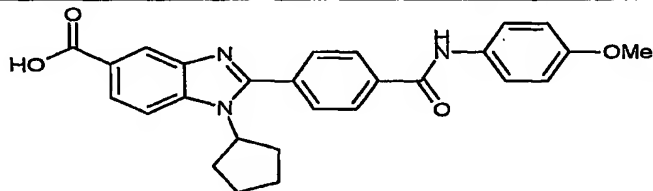
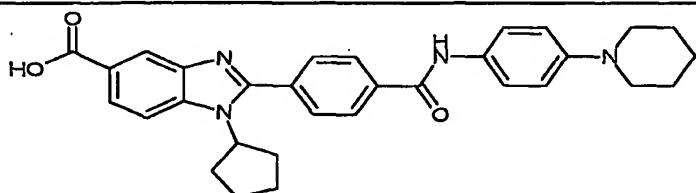
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1193 |  | 512(M+H) |
| 1194 |  | 504(M+H) |
| 1195 |  | 516(M+H) |
| 1196 |  | 497(M+H) |
| 1197 |  | 456(M+H) |
| 1198 |  | 509(M+H) |

表106

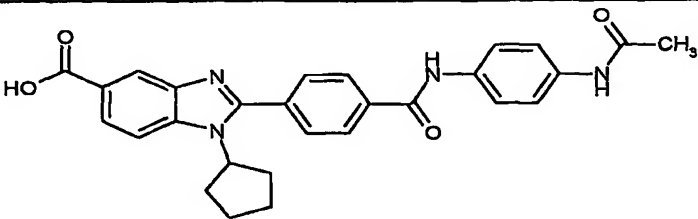
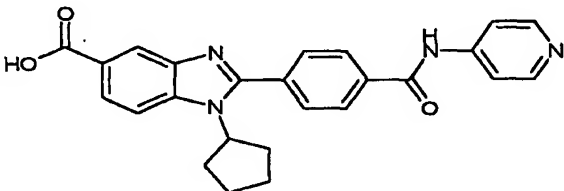
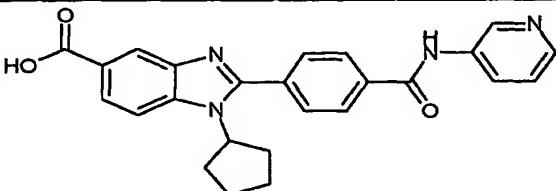
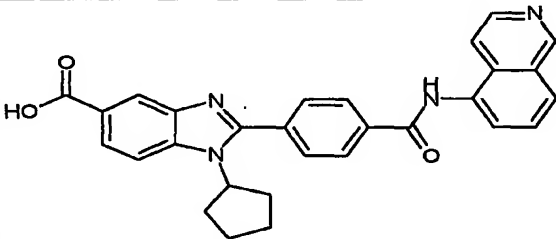
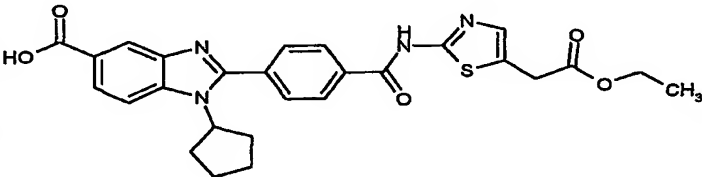
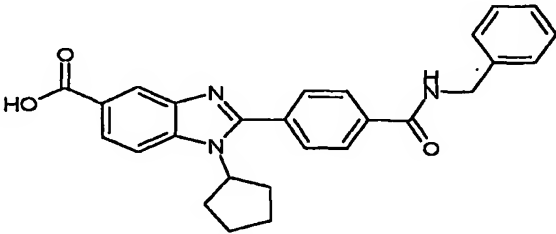
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1199 |  | 483(M+H) |
| 1200 |  | 427(M+H) |
| 1201 |  | 427(M+H) |
| 1202 |  | 477(M+H) |
| 1203 |  | 519(M+H) |
| 1204 |  | 440(M+H) |

表107

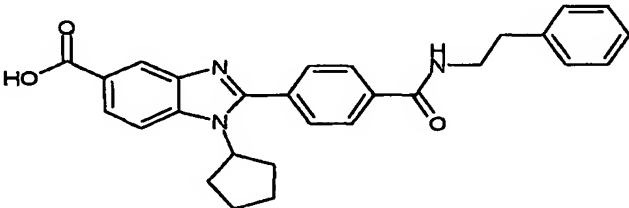
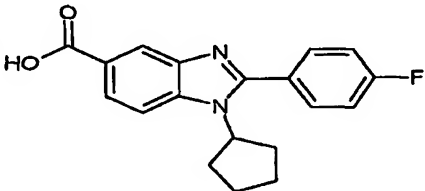
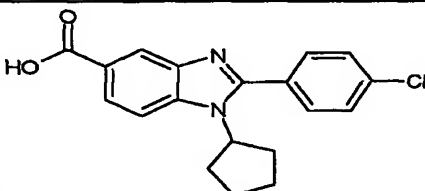
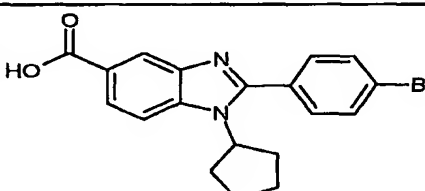
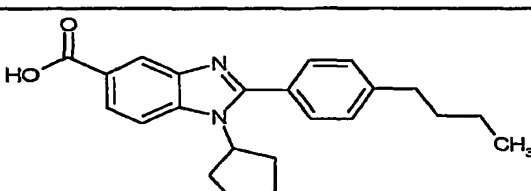
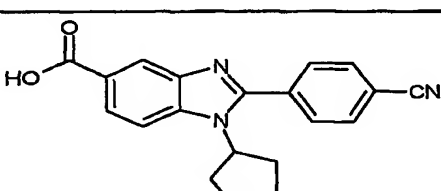
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1205 |  | 454(M+H) |
| 1206 |  | 325(M+H) |
| 1207 |  | 341(M+H) |
| 1208 |  | 385(M+H) |
| 1209 |  | 363(M+H) |
| 1210 |  | 332(M+H) |

表108

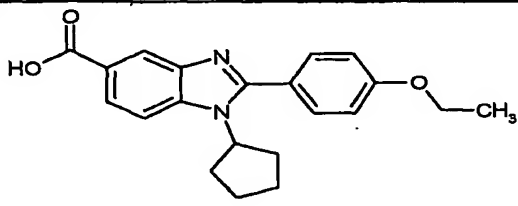
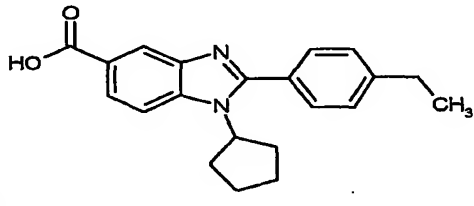
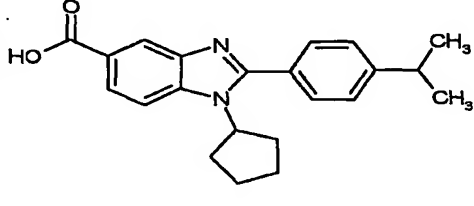
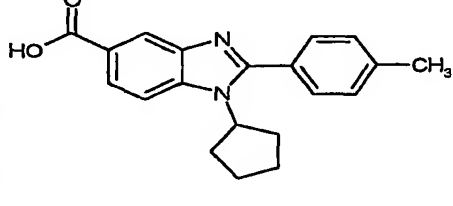
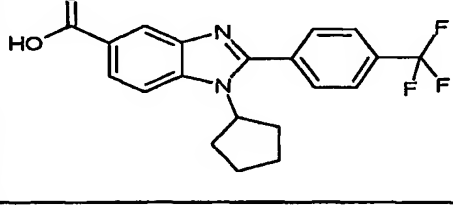
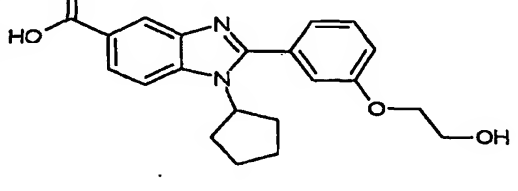
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1211 |  | 351(M+H) |
| 1212 |  | 335(M+H) |
| 1213 |  | 349(M+H) |
| 1214 |  | 321(M+H) |
| 1215 |  | 375(M+H) |
| 1216 |  | 367(M+H) |

表109

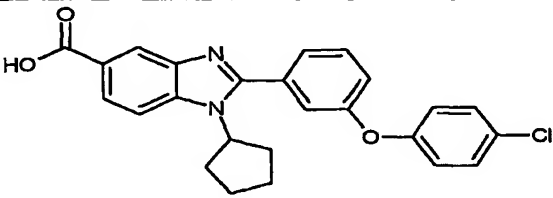
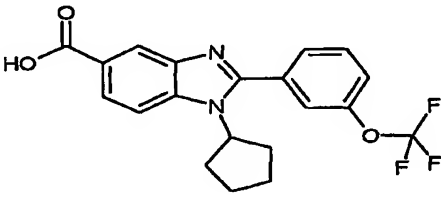
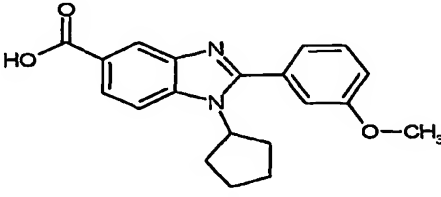
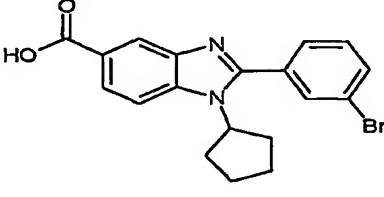
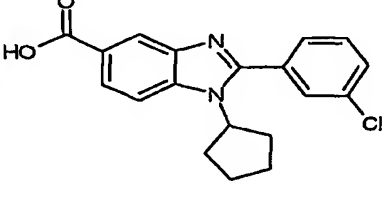
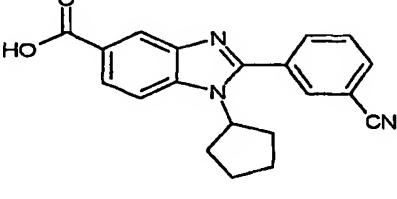
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1217 |  | 433(M+H) |
| 1218 |  | 391(M+H) |
| 1219 |  | 337(M+H) |
| 1220 |  | 385(M+H) |
| 1221 |  | 341(M+H) |
| 1222 |  | 332(M+H) |

表110

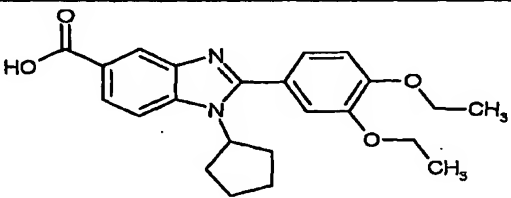
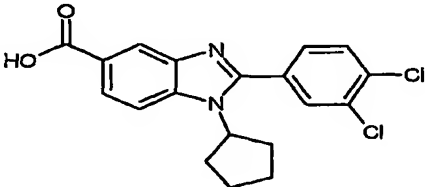
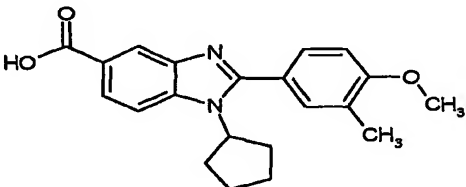
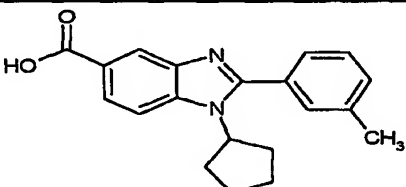
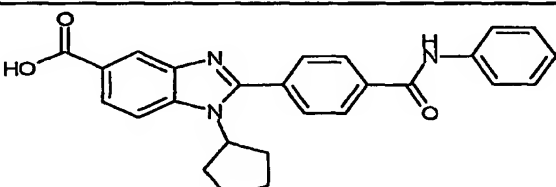
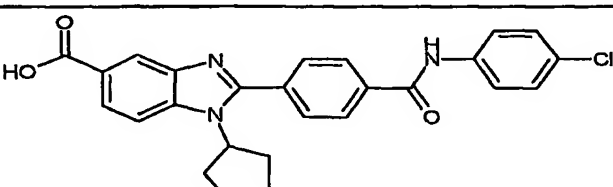
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1223 |  | 395(M+H) |
| 1224 |  | 375(M+H) |
| 1225 |  | 351(M+H) |
| 1226 |  | 321(M+H) |
| 1227 |  | 426(M+H) |
| 1228 |  | 460(M+H) |

表111

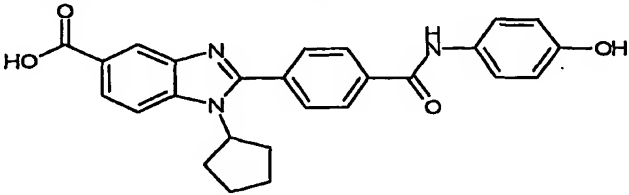
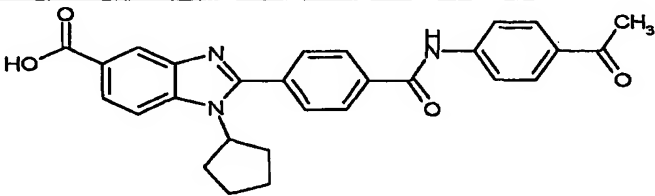
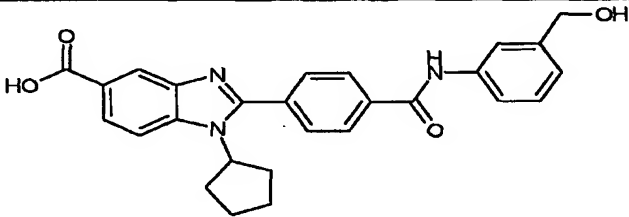
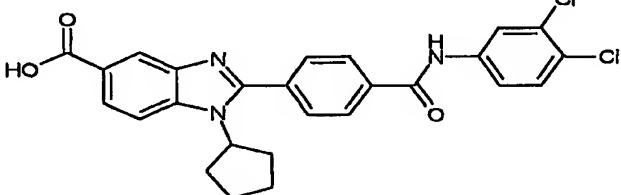
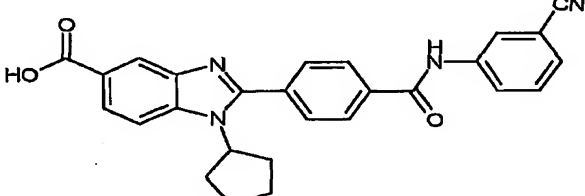
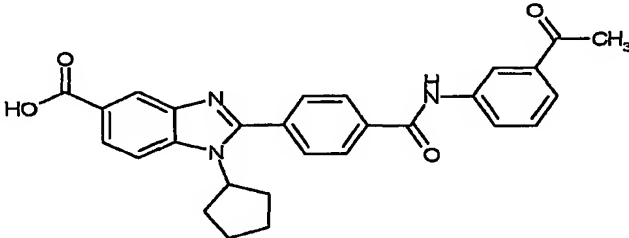
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1229 |  | 442(M+H) |
| 1230 |  | 468(M+H) |
| 1231 |  | 456(M+H) |
| 1232 |  | 494(M+H) |
| 1233 |  | 451(M+H) |
| 1234 |  | 468(M+H) |

表112

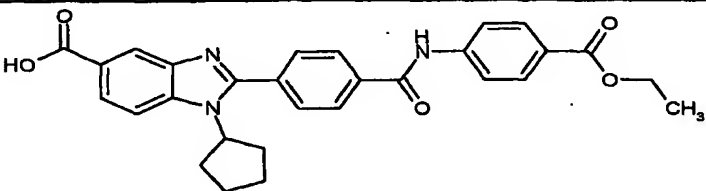
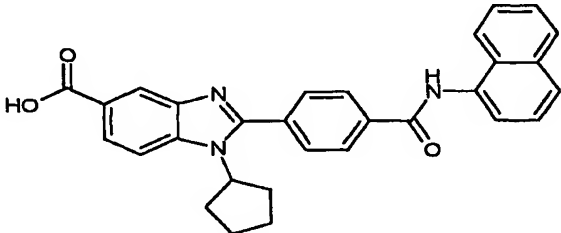
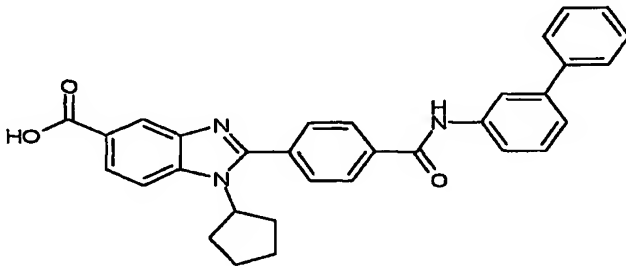
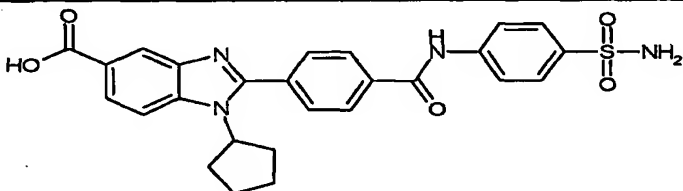
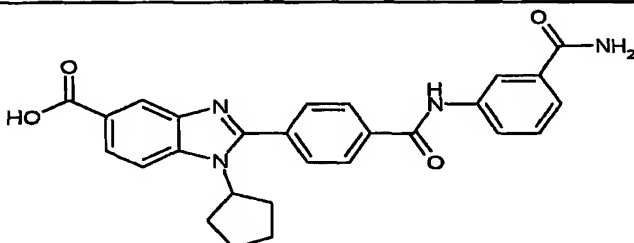
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1235 |  | 498(M+H) |
| 1236 |  | 476(M+H) |
| 1237 |  | 502(M+H) |
| 1238 |  | 505(M+H) |
| 1239 |  | 469(M+H) |

表113

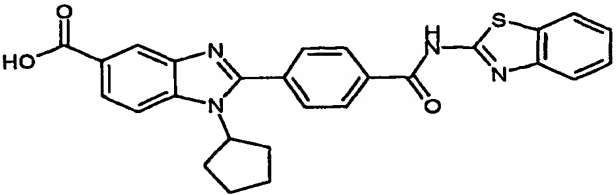
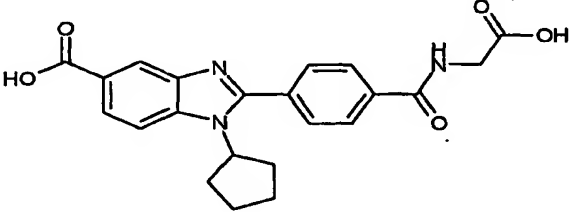
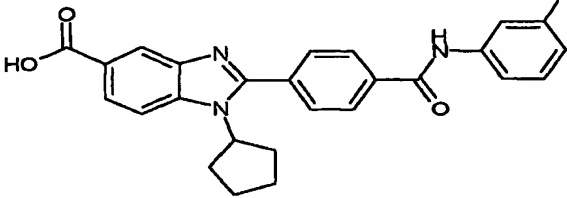
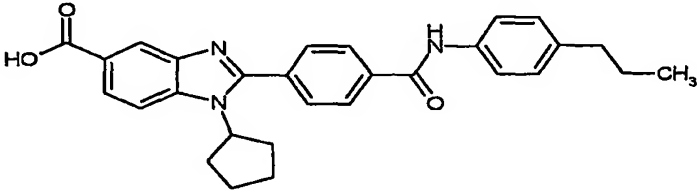
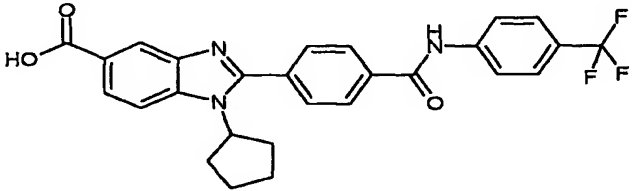
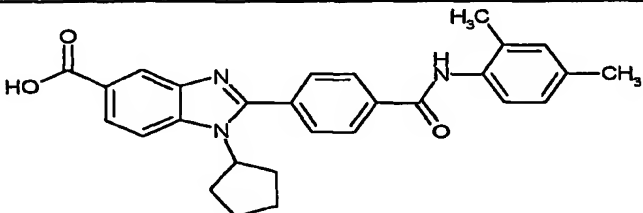
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1240 |  | 483(M+H) |
| 1241 |  | 408(M+H) |
| 1242 |  | 460(M+H) |
| 1243 |  | 468(M+H) |
| 1244 |  | 494(M+H) |
| 1245 |  | 454(M+H) |

表114

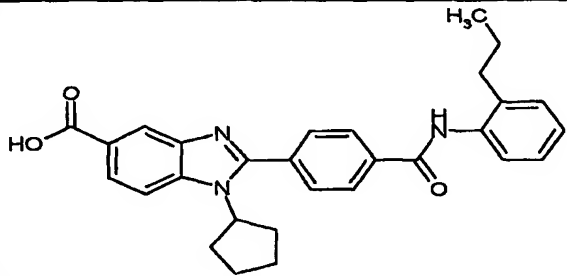
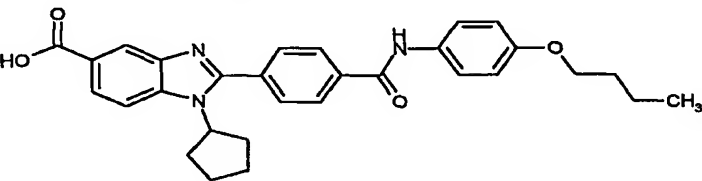
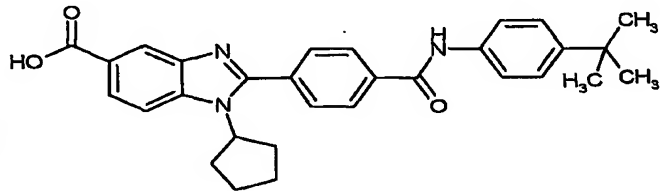
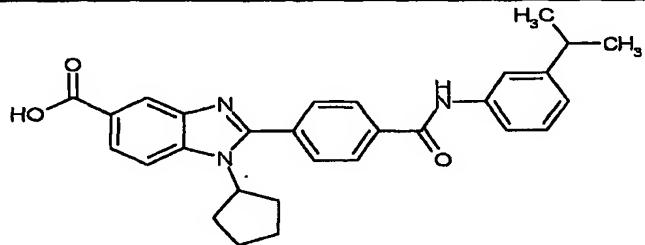
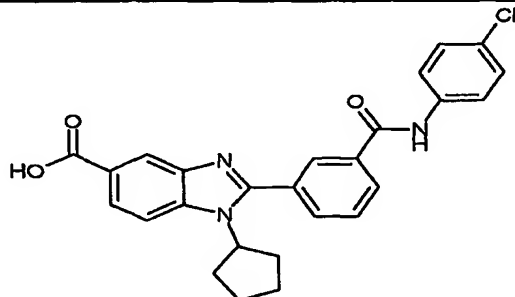
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1246 |  | 468(M+H) |
| 1247 |  | 498(M+H) |
| 1248 |  | 482(M+H) |
| 1249 |  | 468(M+H) |
| 1250 |  | 460(M+H) |

表115

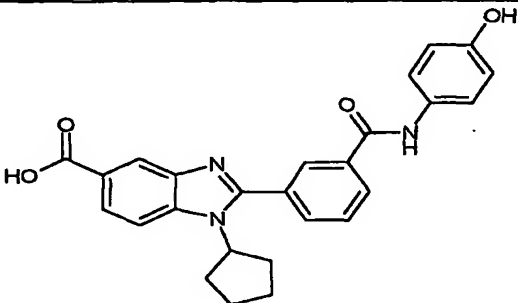
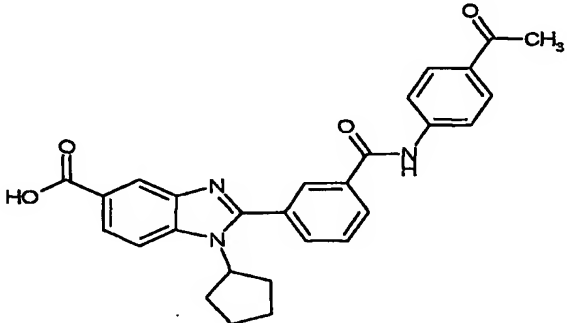
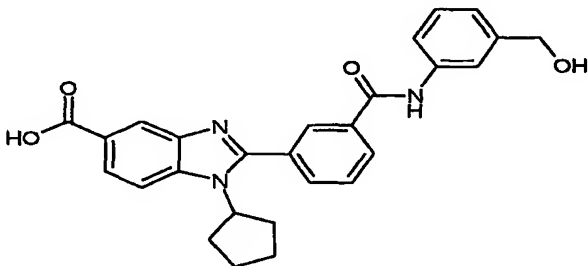
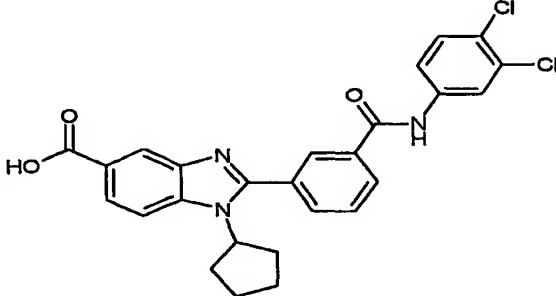
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1251 |  | 442(M+H) |
| 1252 |  | 468(M+H) |
| 1253 |  | 456(M+H) |
| 1254 |  | 494(M+H) |

表116

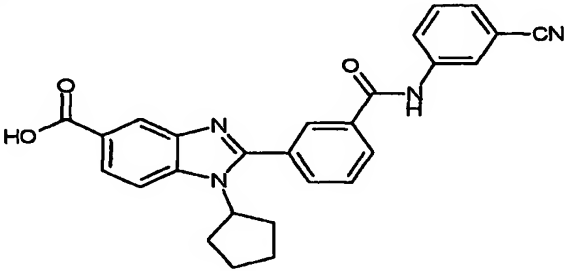
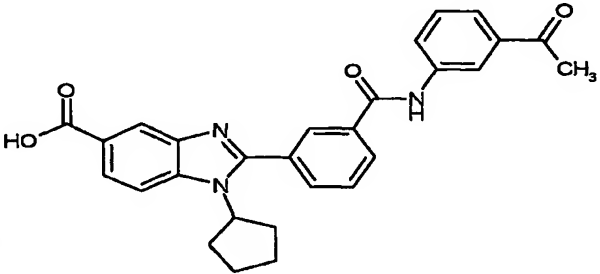
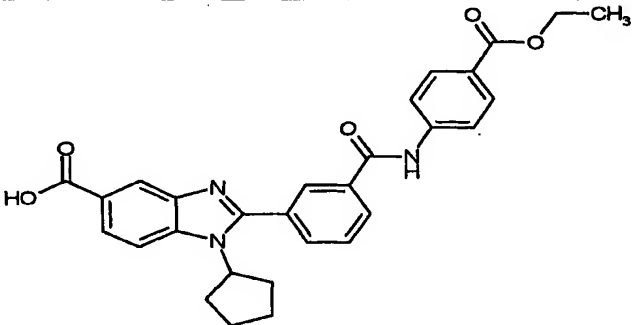
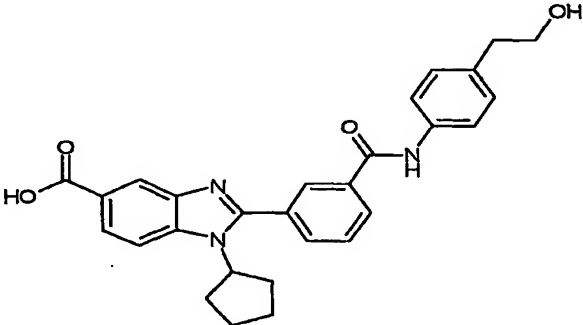
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1255 |  | 451(M+H) |
| 1256 |  | 468(M+H) |
| 1257 |  | 498(M+H) |
| 1258 |  | 470(M+H) |

表117

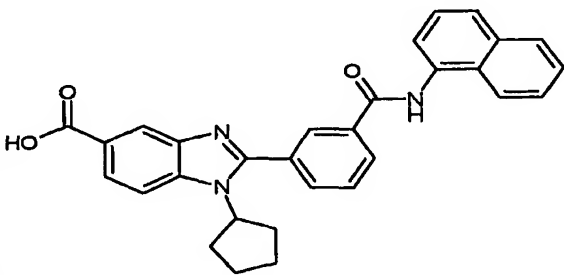
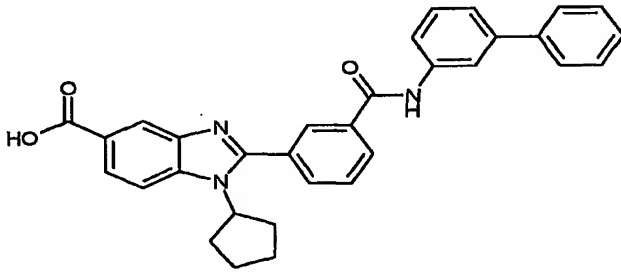
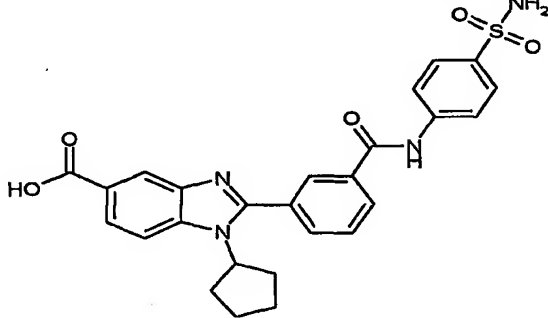
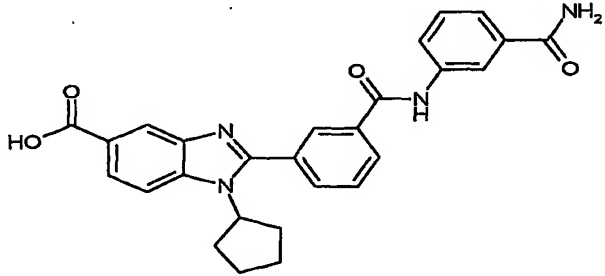
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1259 |  | 476(M+H) |
| 1260 |  | 502(M+H) |
| 1261 |  | 505(M+H) |
| 1262 |  | 469(M+H) |

表118

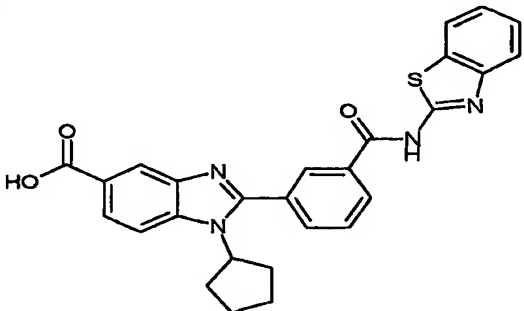
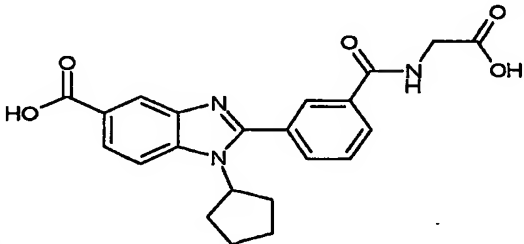
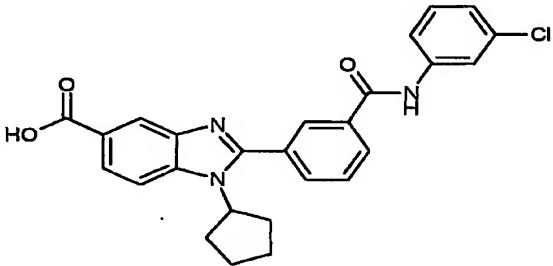
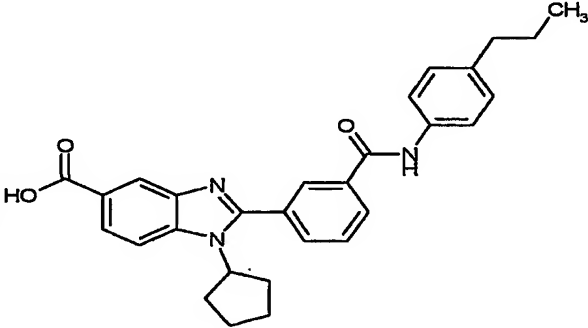
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1263 |  | 483(M+H) |
| 1264 |  | 408(M+H) |
| 1265 |  | 460(M+H) |
| 1266 |  | 468(M+H) |

表119

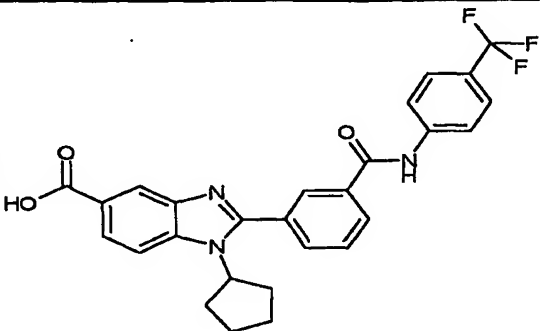
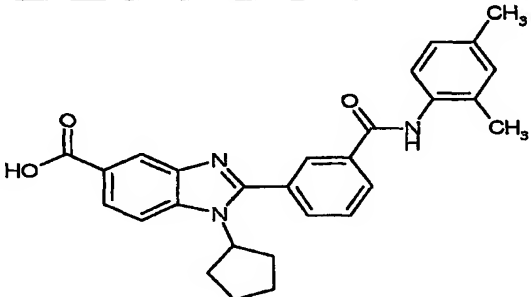
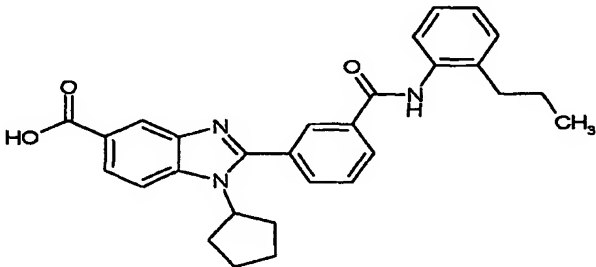
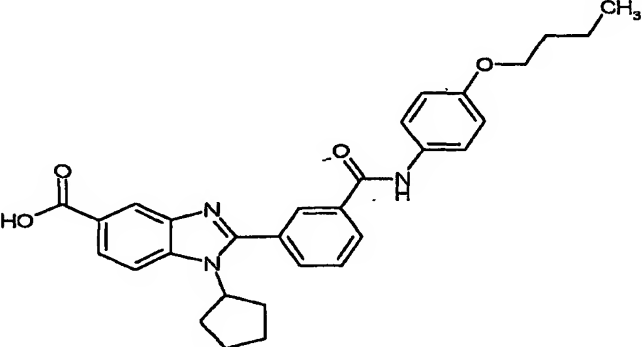
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1267 |  | 494(M+H) |
| 1268 |  | 454(M+H) |
| 1269 |  | 468(M+H) |
| 1270 |  | 498(M+H) |

表120

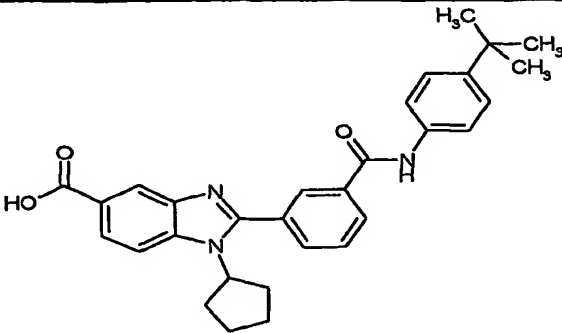
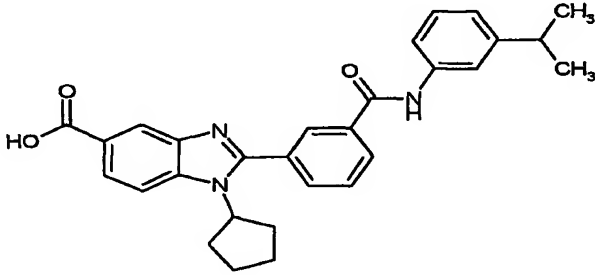
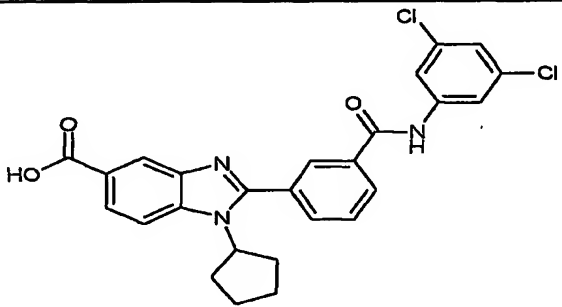
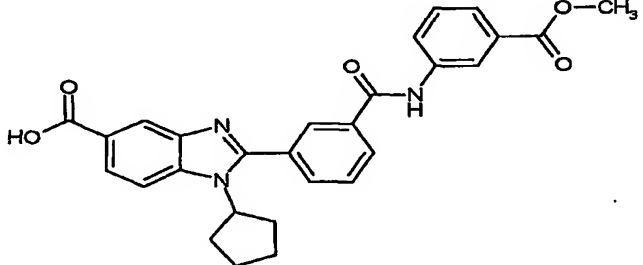
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1271 |  | 482(M+H) |
| 1272 |  | 468(M+H) |
| 1273 |  | 494(M+H) |
| 1274 |  | 484(M+H) |

表121

| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---|----------|
| 1275 | | 519(M+H) |
| 1276 | | 427(M+H) |
| 1277 | | 456(M+H) |
| 1278 | | 516(M+H) |

表122

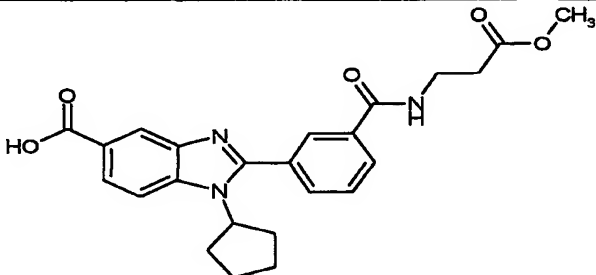
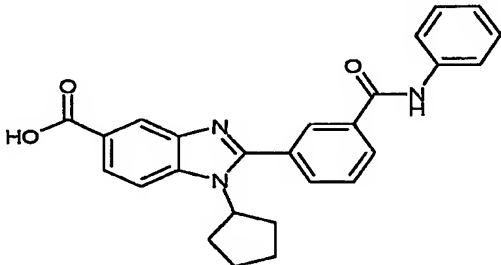
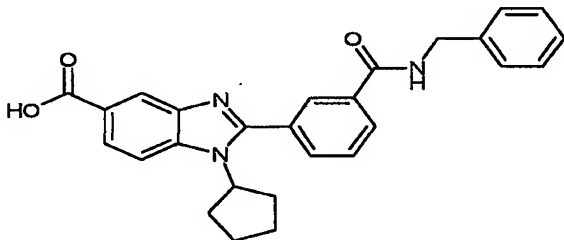
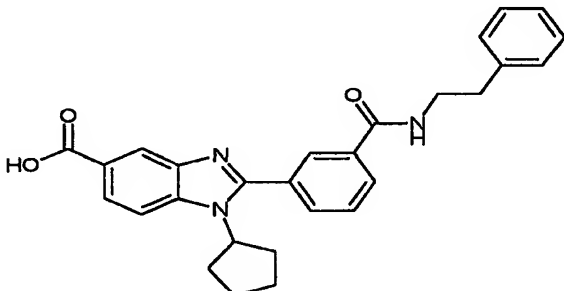
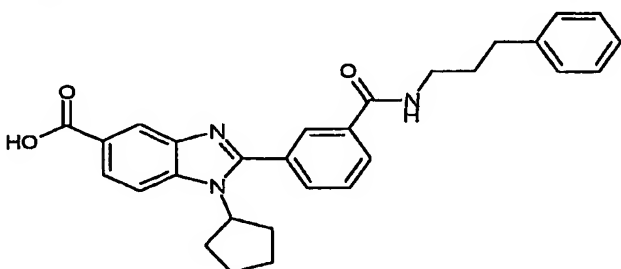
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1279 |  | 436(M+H) |
| 1280 |  | 426(M+H) |
| 1281 |  | 440(M+H) |
| 1282 |  | 454(M+H) |
| 1283 |  | 468(M+H) |

表123

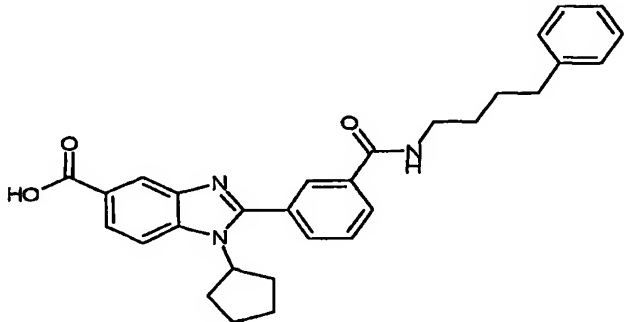
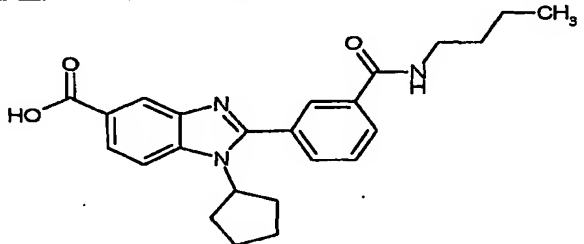
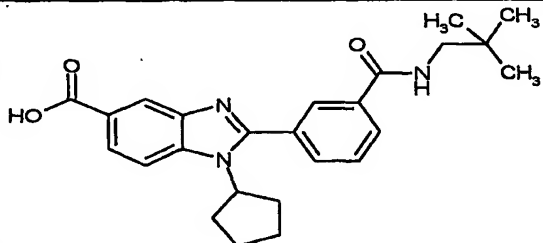
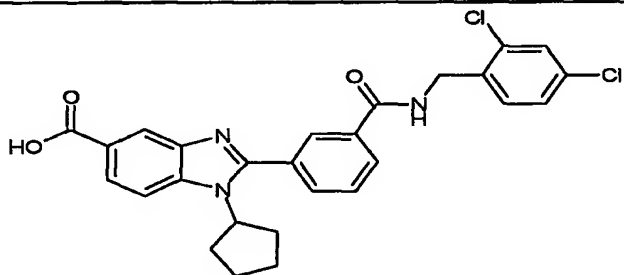
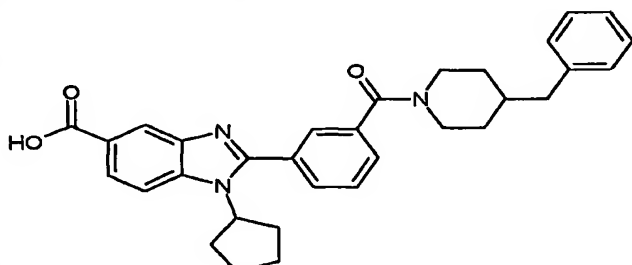
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1284 |  | 482(M+H) |
| 1285 |  | 406(M+H) |
| 1286 |  | 420(M+H) |
| 1287 |  | 508(M+H) |
| 1288 |  | 508(M+H) |

表124

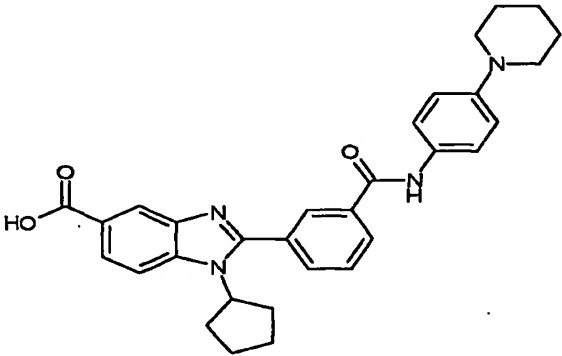
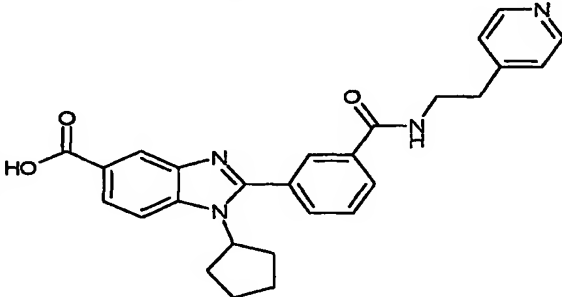
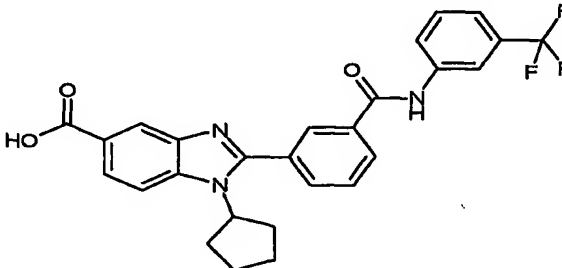
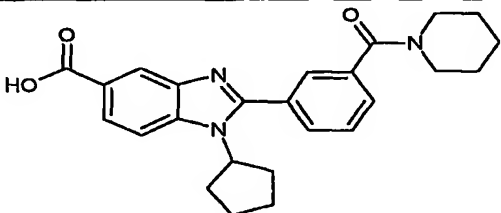
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1289 |  | 509(M+H) |
| 1290 |  | 455(M+H) |
| 1291 |  | 494(M+H) |
| 1292 |  | 418(M+H) |

表125

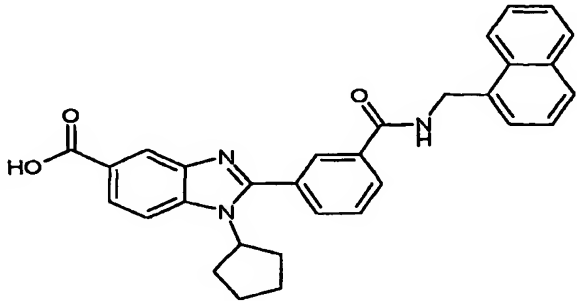
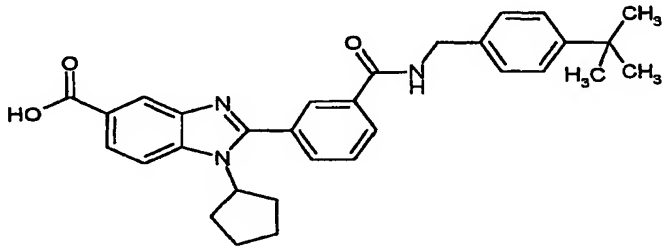
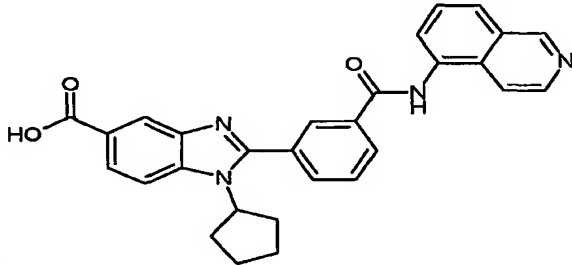
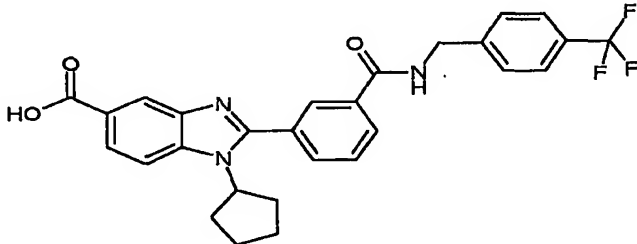
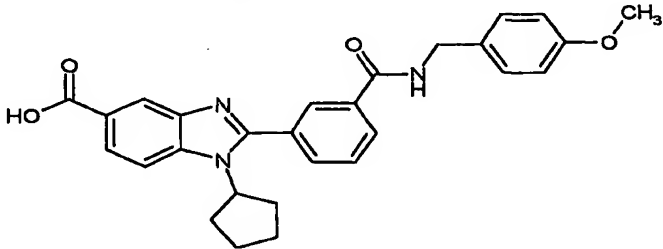
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1293 |  | 490(M+H) |
| 1294 |  | 496(M+H) |
| 1295 |  | 477(M+H) |
| 1296 |  | 508(M+H) |
| 1297 |  | 470(M+H) |

表126

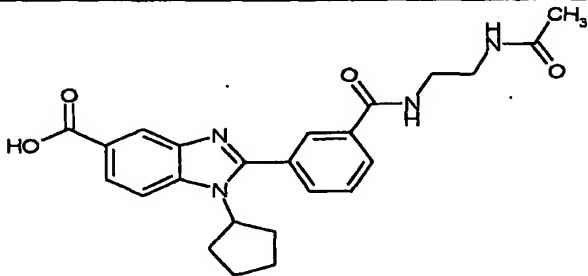
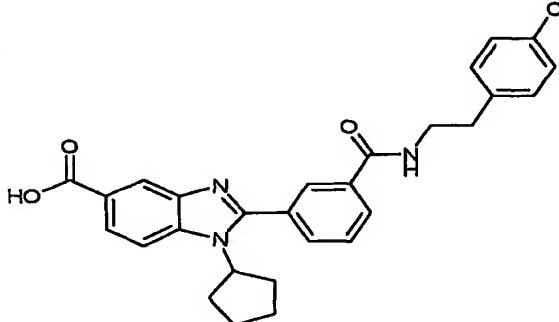
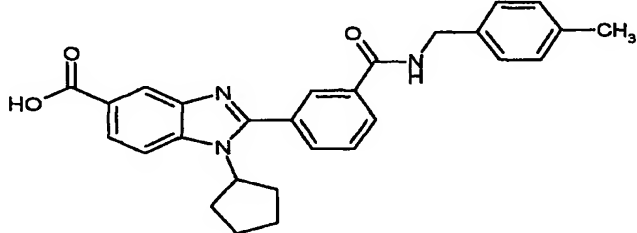
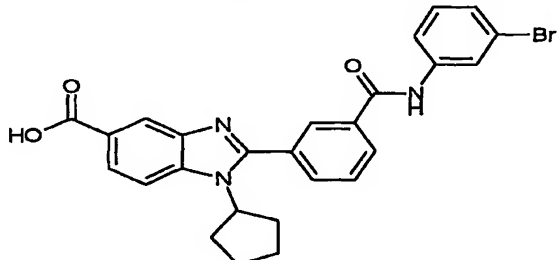
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1298 |  | 435(M+H) |
| 1299 |  | 488(M+H) |
| 1300 |  | 454(M+H) |
| 1301 |  | 504(M+H) |

表127

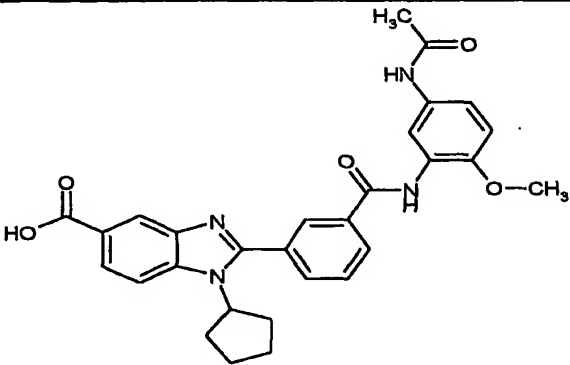
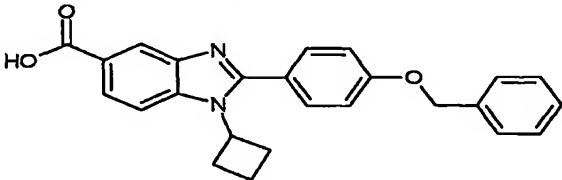
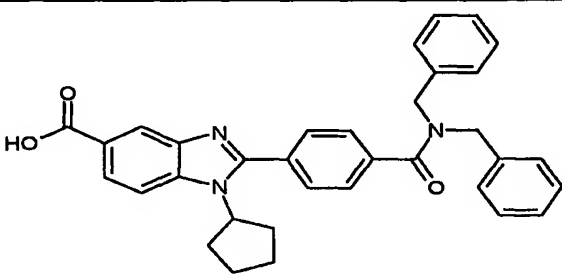
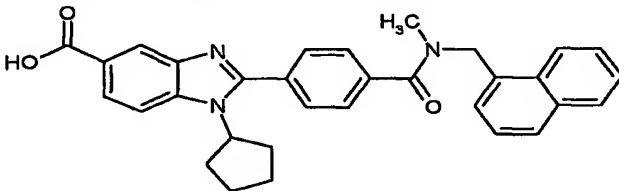
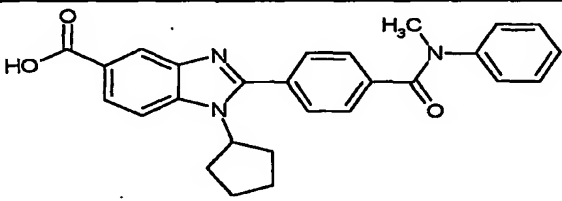
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1302 |  | 513(M+H) |
| 1303 |  | 399(M+H) |
| 1304 |  | 530(M+H) |
| 1305 |  | 504(M+H) |
| 1306 |  | 440(M+H) |

表128

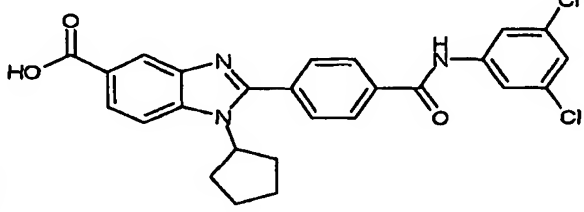
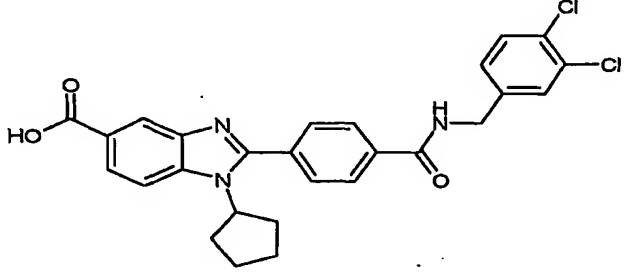
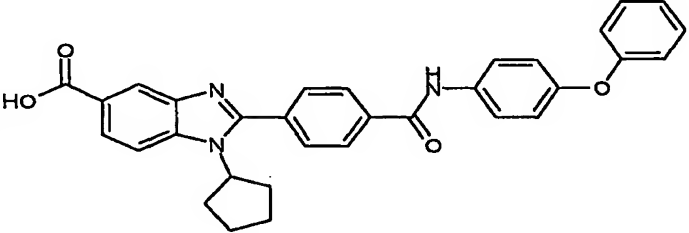
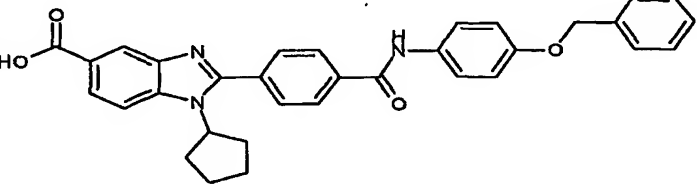
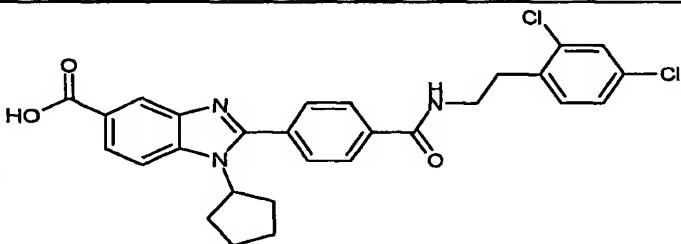
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1307 |  | 494(M+H) |
| 1308 |  | 508(M+H) |
| 1309 |  | 518(M+H) |
| 1310 |  | 532(M+H) |
| 1311 |  | 522(M+H) |

表129

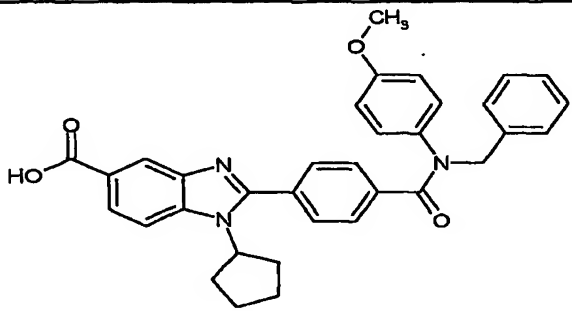
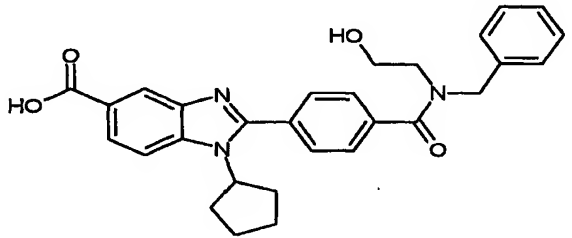
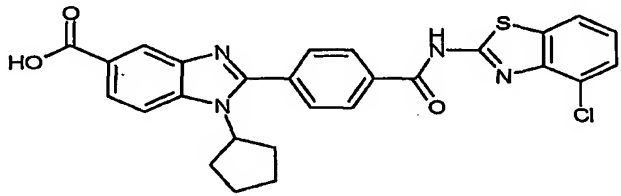
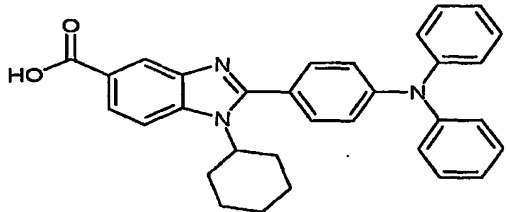
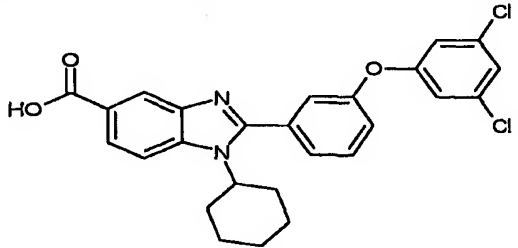
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1312 |  | 546(M+H) |
| 1313 |  | 484(M+H) |
| 1314 |  | 517(M+H) |
| 1315 |  | 488(M+H) |
| 1316 |  | 481(M+H) |

表130

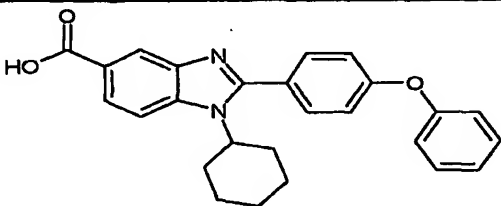
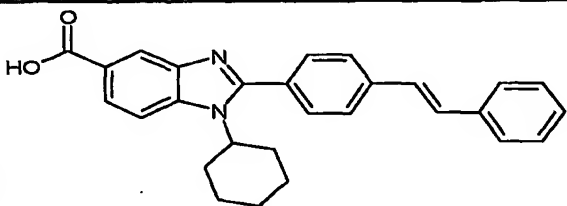
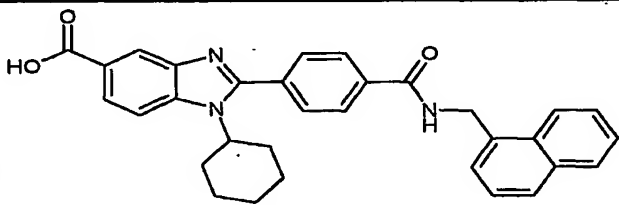
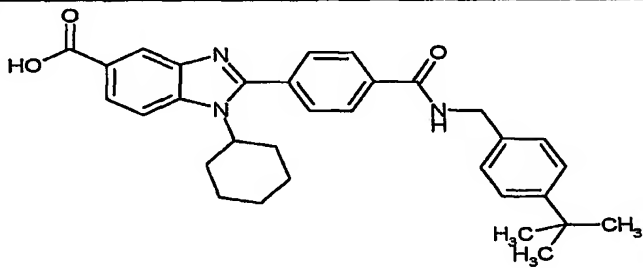
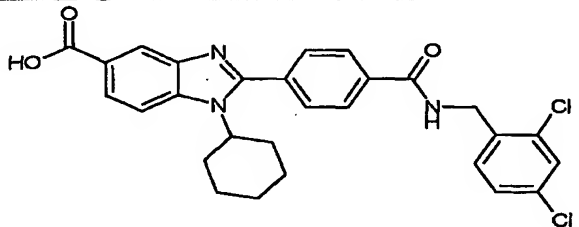
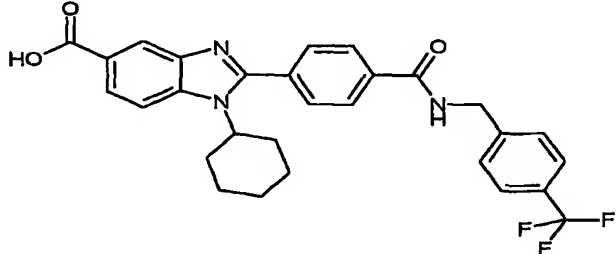
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1317 |  | 413(M+H) |
| 1318 |  | 423(M+H) |
| 1319 |  | 504(M+H) |
| 1320 |  | 510(M+H) |
| 1321 |  | 522(M+H) |
| 1322 |  | 522(M+H) |

表131

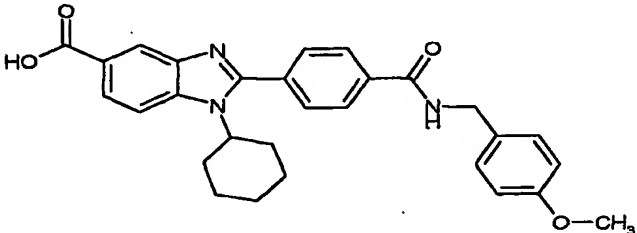
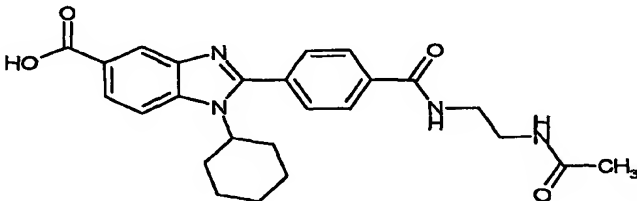
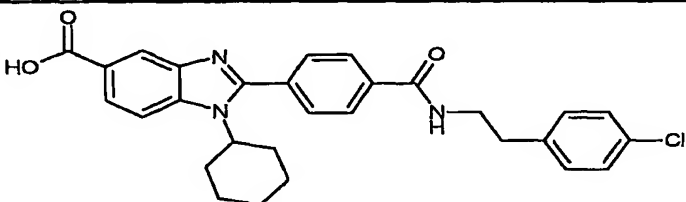
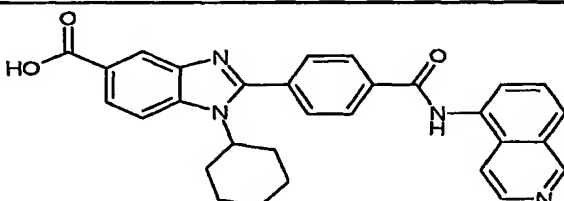
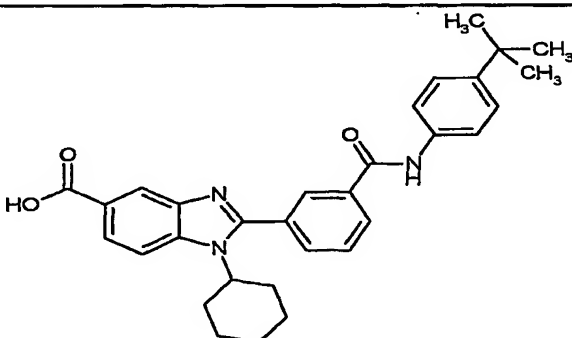
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1323 |  | 484(M+H) |
| 1324 |  | 449(M+H) |
| 1325 |  | 502(M+H) |
| 1326 |  | 491(M+H) |
| 1327 |  | 496(M+H) |

表132

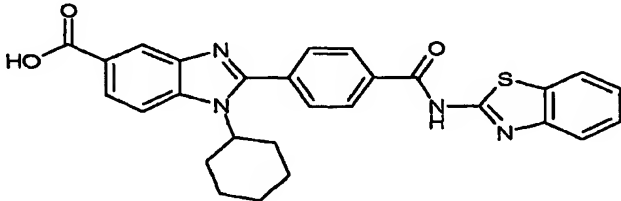
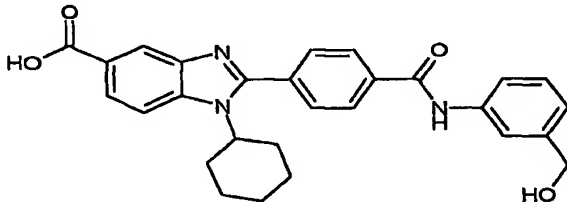
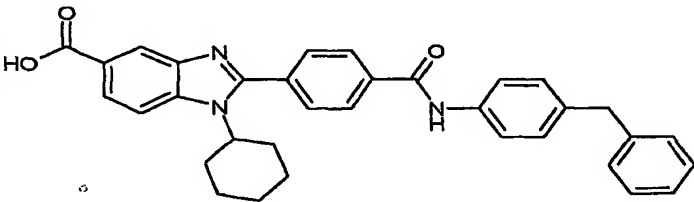
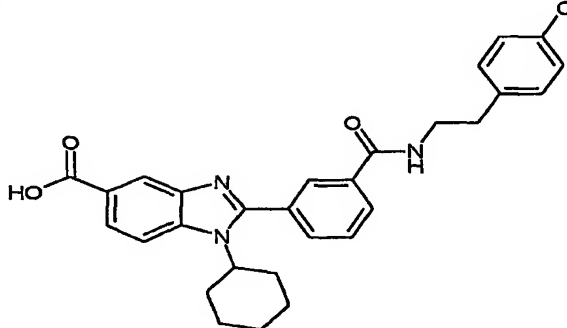
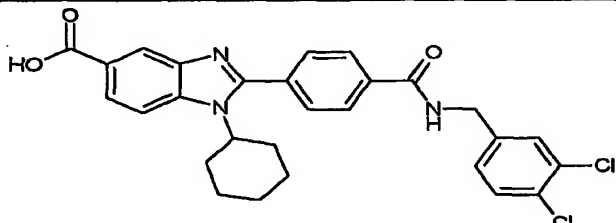
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1328 |  | 497(M+H) |
| 1329 |  | 470(M+H) |
| 1330 |  | 530(M+H) |
| 1331 |  | 502(M+H) |
| 1332 |  | 522(M+H) |

表133

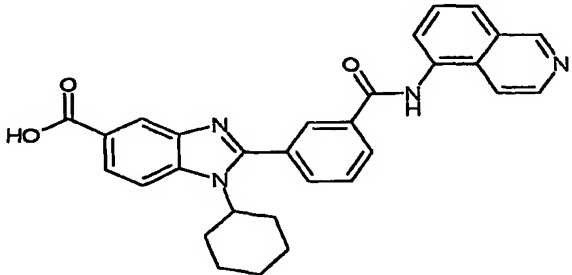
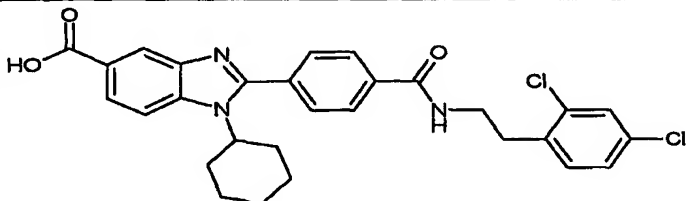
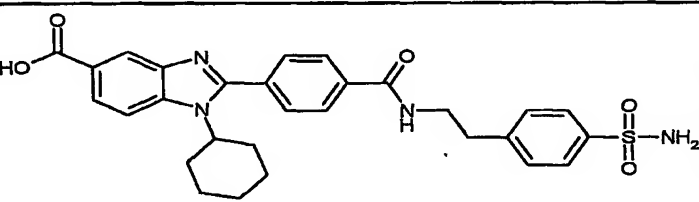
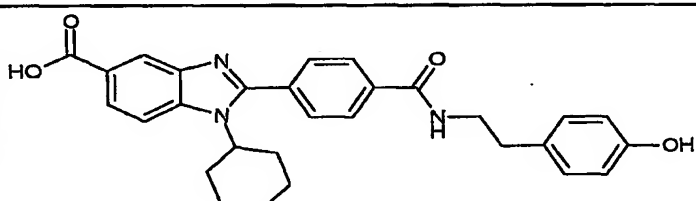
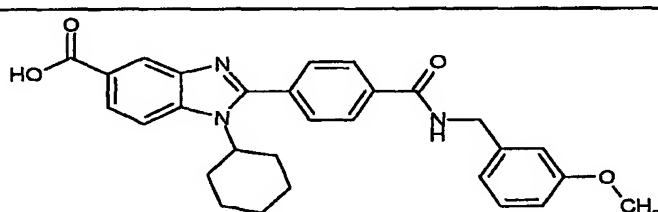
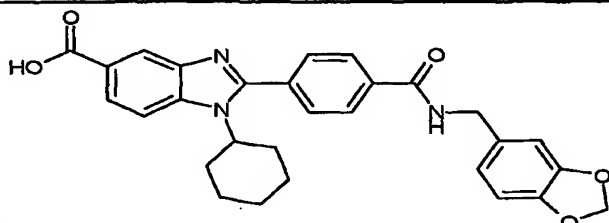
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1333 |  | 491(M+H) |
| 1334 |  | 536(M+H) |
| 1335 |  | 547(M+H) |
| 1336 |  | 484(M+H) |
| 1337 |  | 484(M+H) |
| 1338 |  | 498(M+H) |

表134

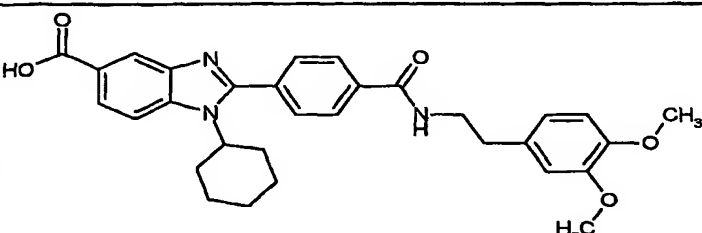
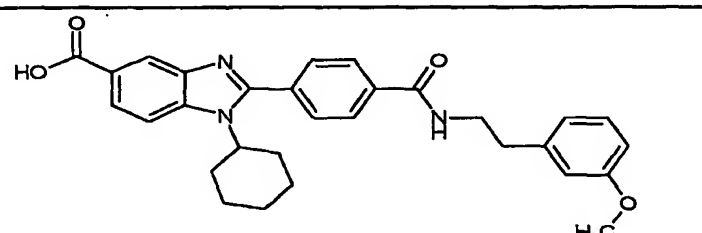
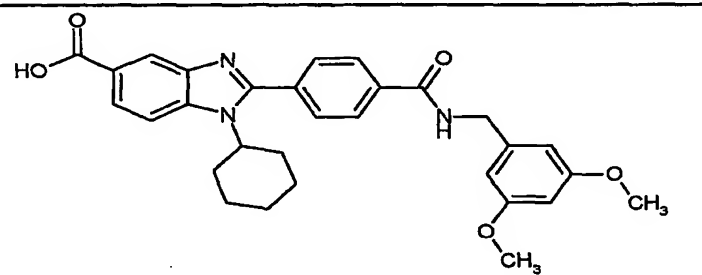
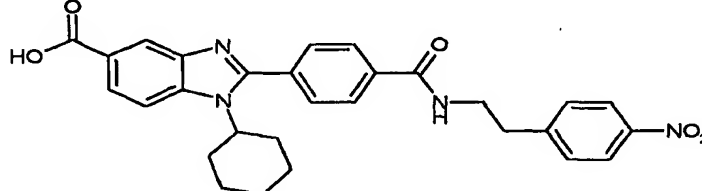
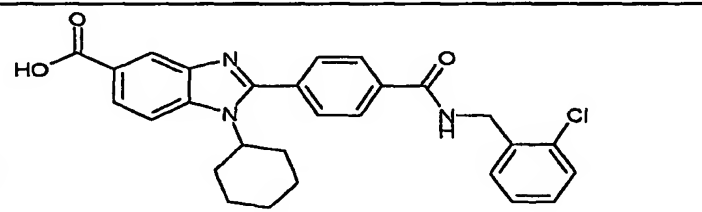
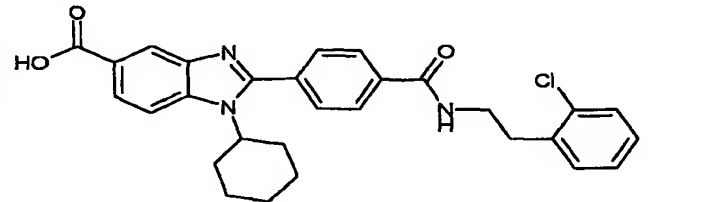
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1339 |  | 528(M+H) |
| 1340 |  | 498(M+H) |
| 1341 |  | 514(M+H) |
| 1342 |  | 513(M+H) |
| 1343 |  | 488(M+H) |
| 1344 |  | 502(M+H) |

表135

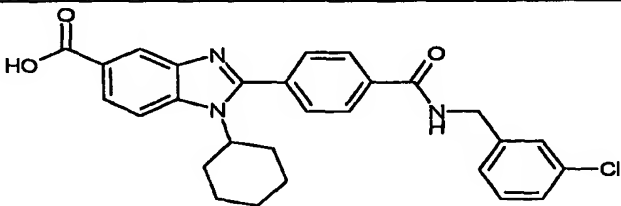
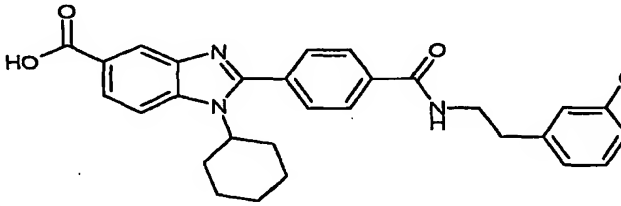
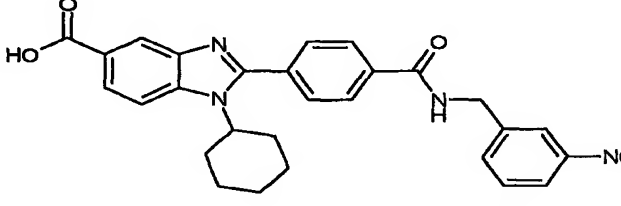
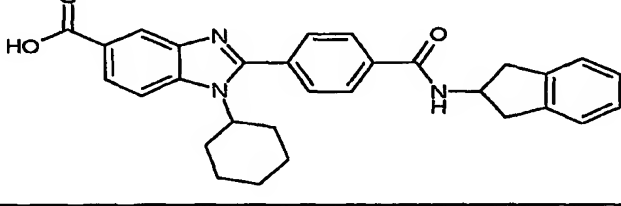
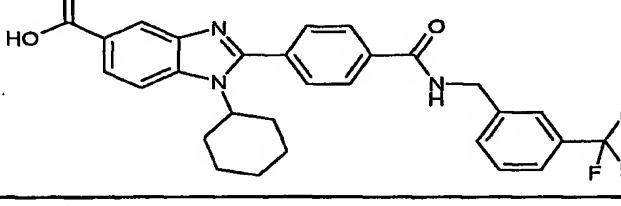
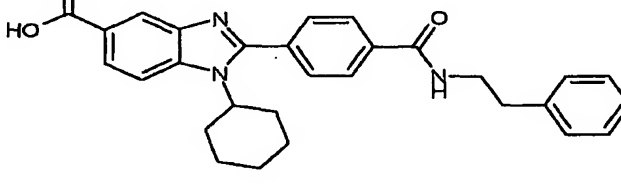
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1345 |  | 488(M+H) |
| 1346 |  | 502(M+H) |
| 1347 |  | 499(M+H) |
| 1348 |  | 480(M+H) |
| 1349 |  | 522(M+H) |
| 1350 |  | 546(M+H) |

表136

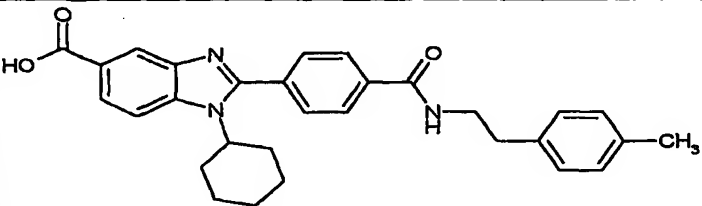
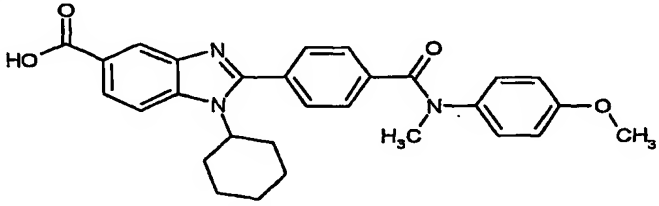
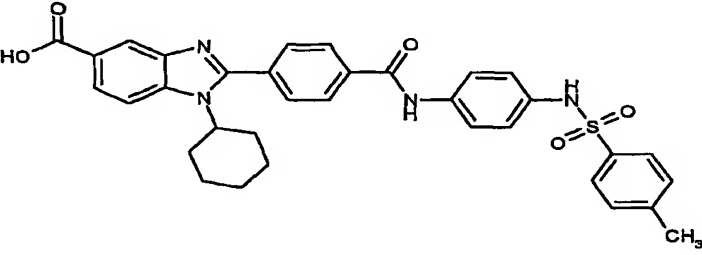
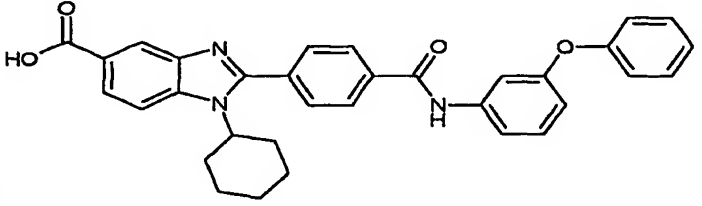
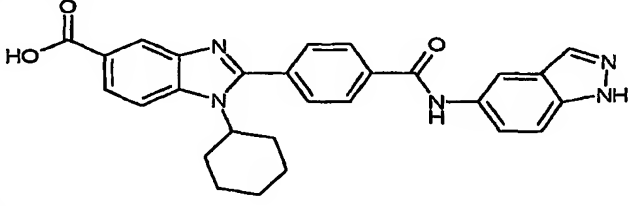
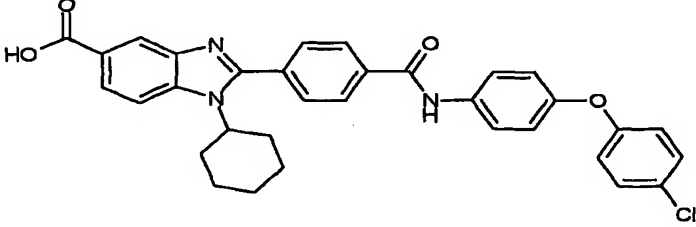
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1351 |  | 482(M+H) |
| 1352 |  | 484(M+H) |
| 1353 |  | 609(M+H) |
| 1354 |  | 532(M+H) |
| 1355 |  | 480(M+H) |
| 1356 |  | 566(M+H) |

表137

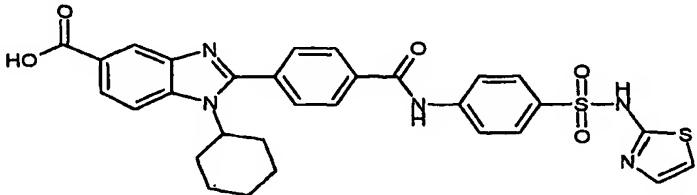
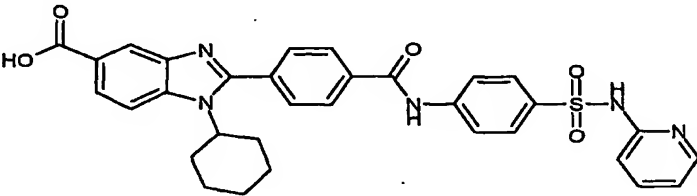
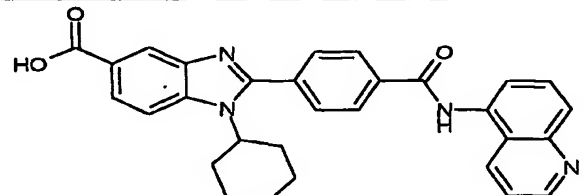
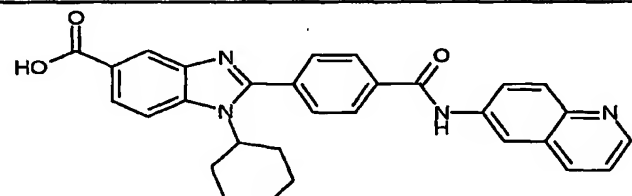
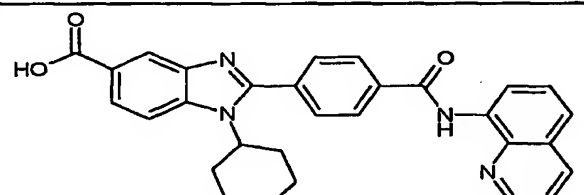
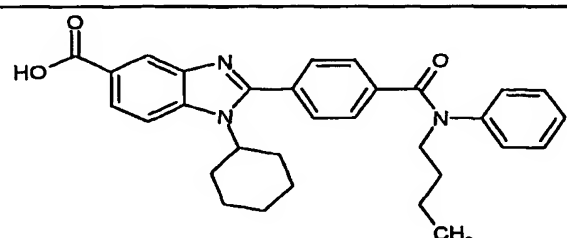
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1357 |  | 602(M+H) |
| 1358 |  | 596(M+H) |
| 1359 |  | 491(M+H) |
| 1360 |  | 491(M+H) |
| 1361 |  | 491(M+H) |
| 1362 |  | 496(M+H) |

表138

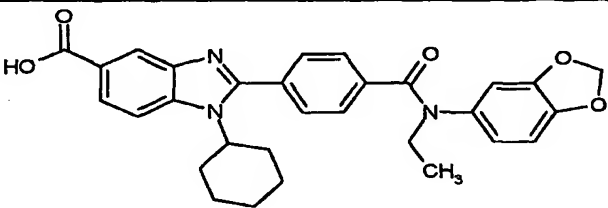
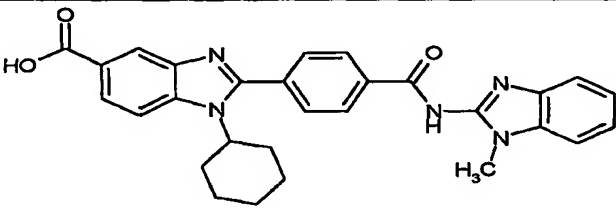
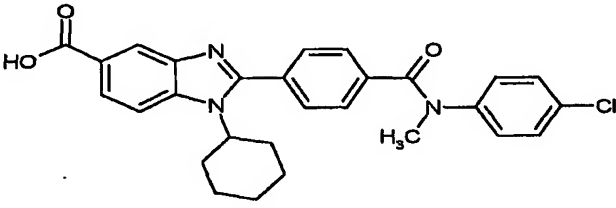
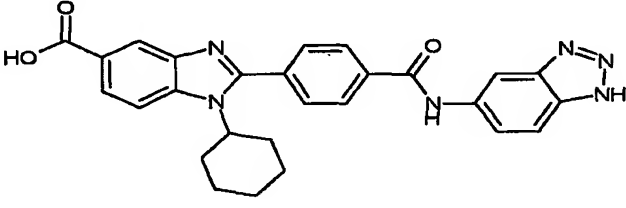
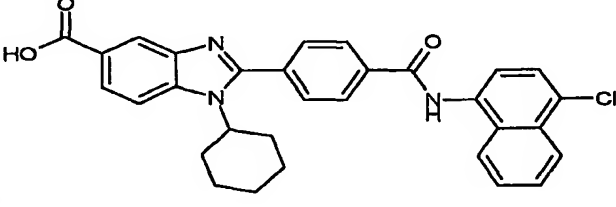
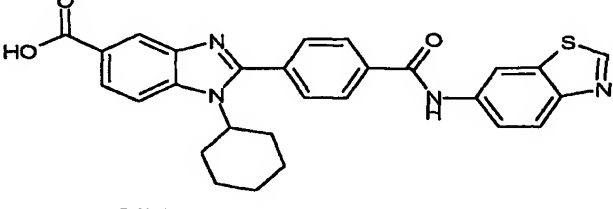
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1363 |  | 512(M+H) |
| 1364 |  | 494(M+H) |
| 1365 |  | 488(M+H) |
| 1366 |  | 481(M+H) |
| 1367 |  | 524(M+H) |
| 1368 |  | 497(M+H) |

表139

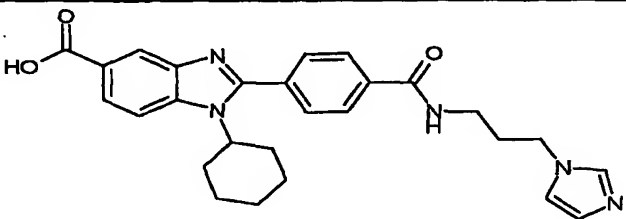
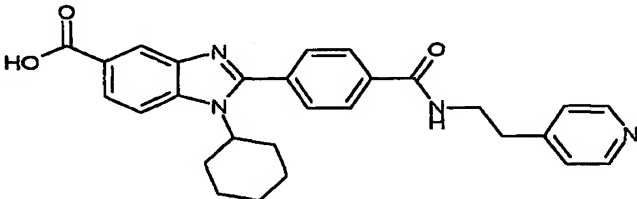
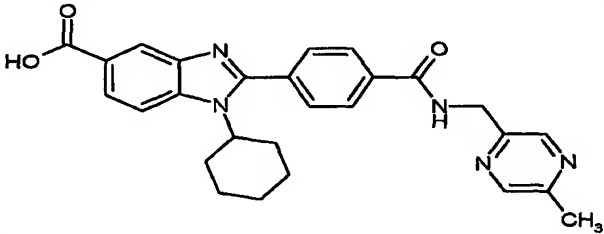
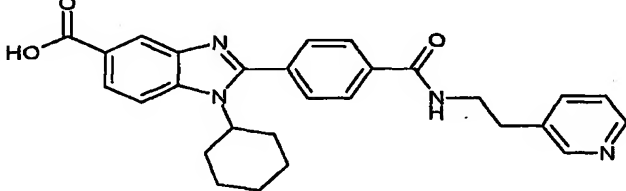
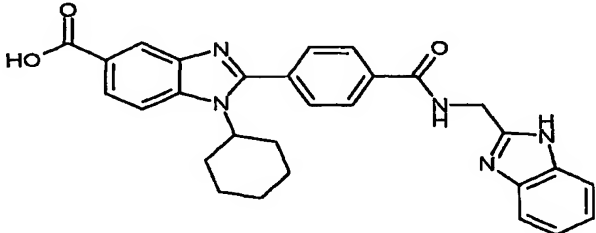
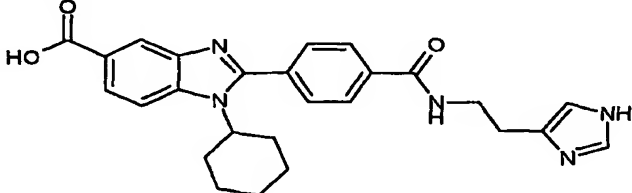
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1369 |  | 472(M+H) |
| 1370 |  | 469(M+H) |
| 1371 |  | 470(M+H) |
| 1372 |  | 469(M+H) |
| 1373 |  | 494(M+H) |
| 1374 |  | 458(M+H) |

表140

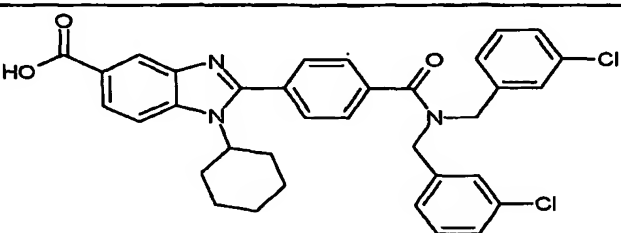
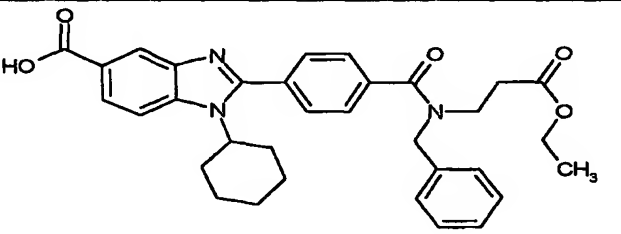
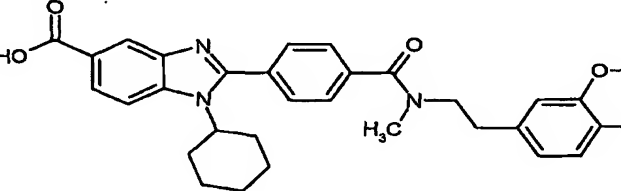
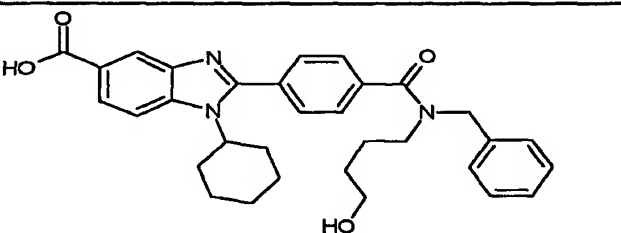
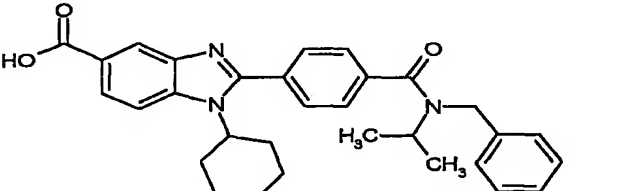
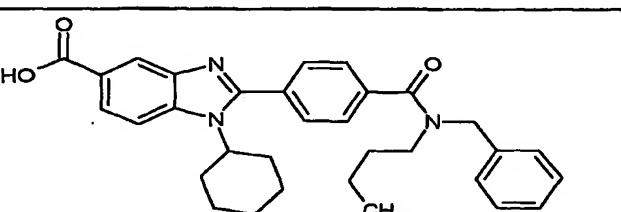
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1375 |  | 612(M+H) |
| 1376 |  | 554(M+H) |
| 1377 |  | 542(M+H) |
| 1378 |  | 526(M+H) |
| 1379 |  | 496(M+H) |
| 1380 |  | 510(M+H) |

表141

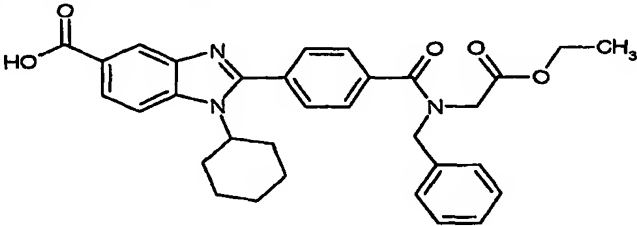
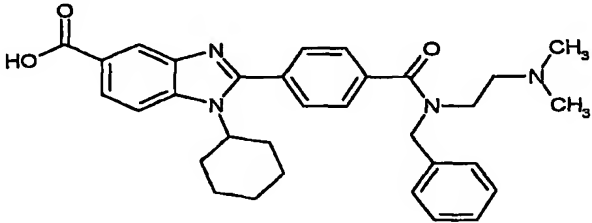
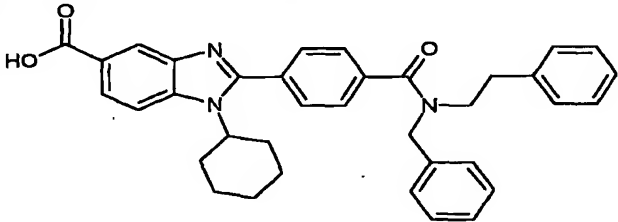
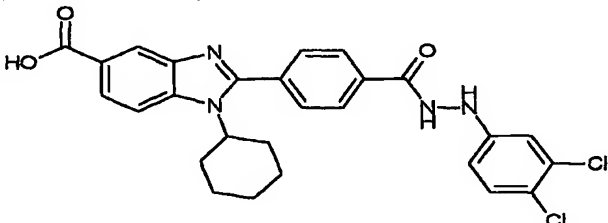
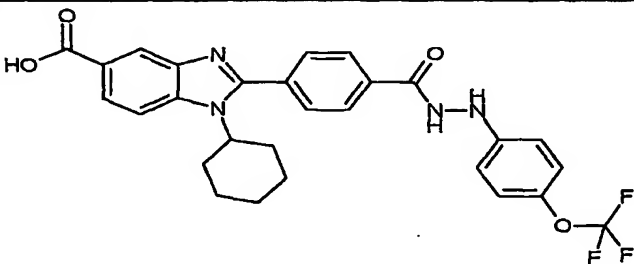
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1381 |  | 540(M+H) |
| 1382 |  | 525(M+H) |
| 1383 |  | 558(M+H) |
| 1384 |  | 523(M+H) |
| 1385 |  | 539(M+H) |

表142

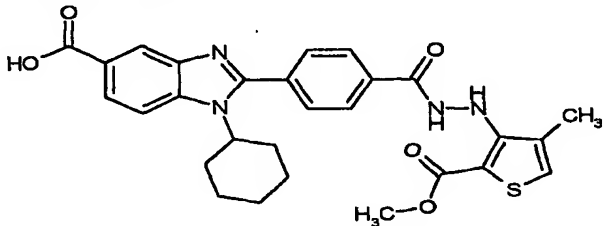
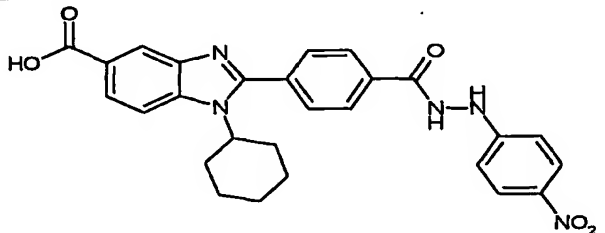
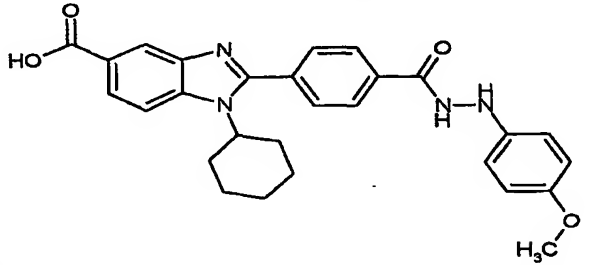
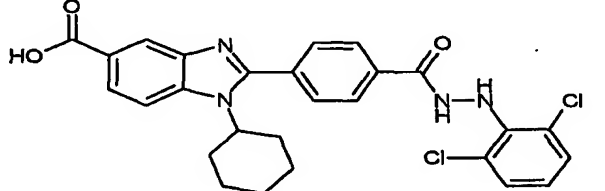
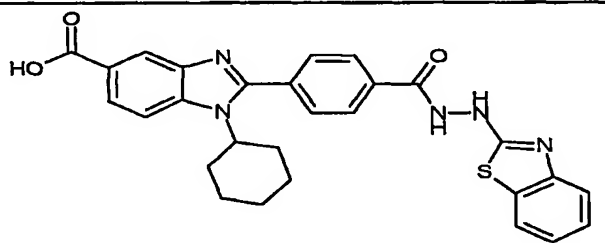
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1386 |  | 533(M+H) |
| 1387 |  | 500(M+H) |
| 1388 |  | 485(M+H) |
| 1389 |  | 523(M+H) |
| 1390 |  | 512(M+H) |

表143

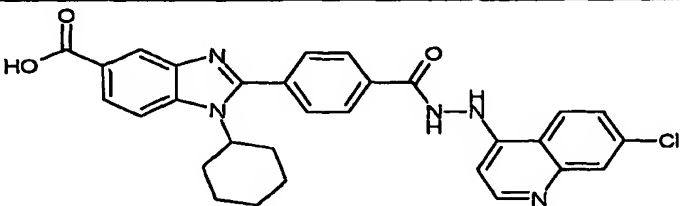
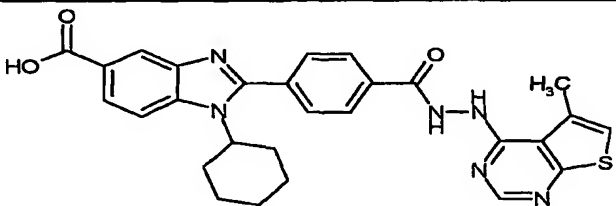
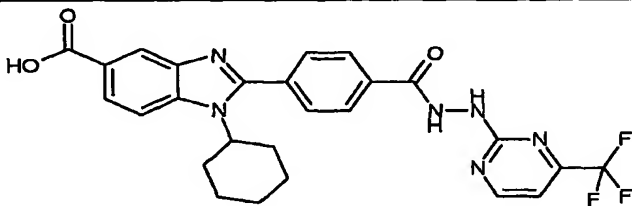
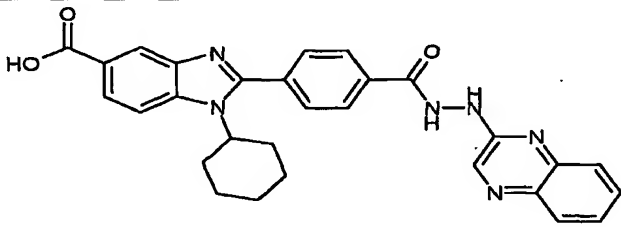
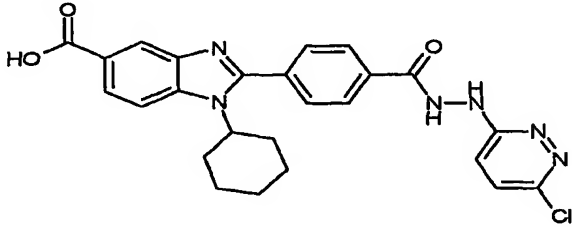
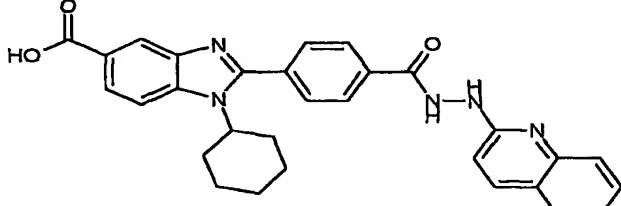
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1391 |  | 540(M+H) |
| 1392 |  | 527(M+H) |
| 1393 |  | 525(M+H) |
| 1394 |  | 507(M+H) |
| 1395 |  | 491(M+H) |
| 1396 |  | 506(M+H) |

表144

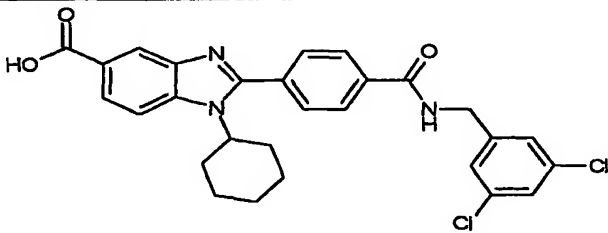
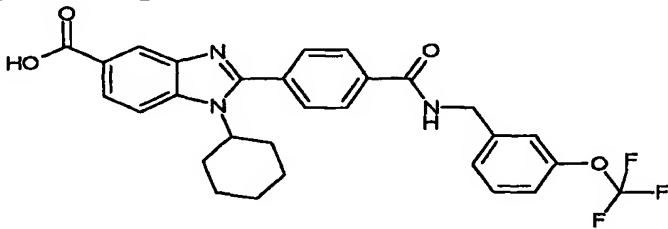
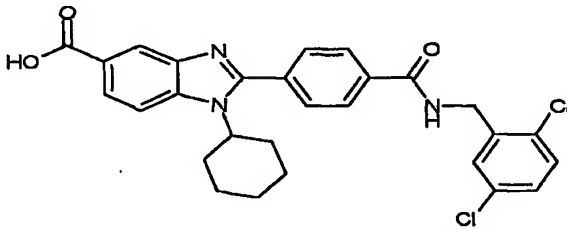
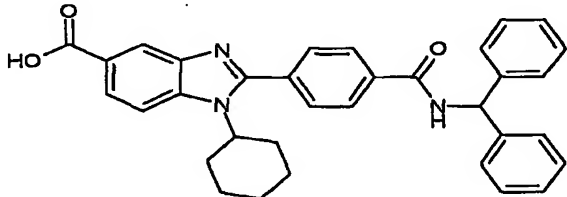
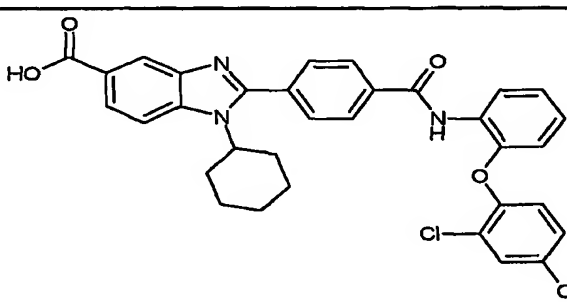
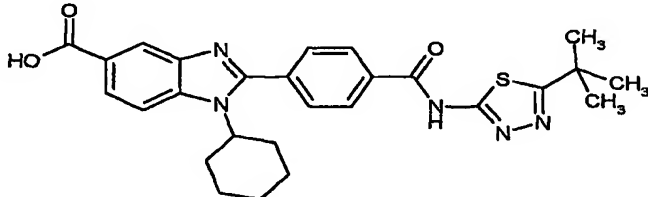
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1397 |  | 522(M+H) |
| 1398 |  | 538(M+H) |
| 1399 |  | 522(M+H) |
| 1400 |  | 530(M+H) |
| 1401 |  | 600(M+H) |
| 1402 |  | 504(M+H) |

表145

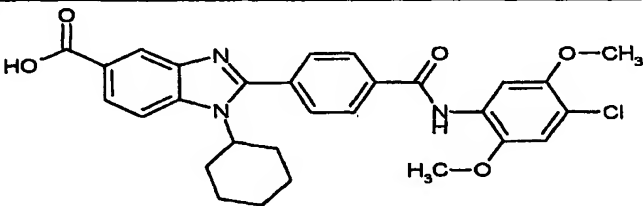
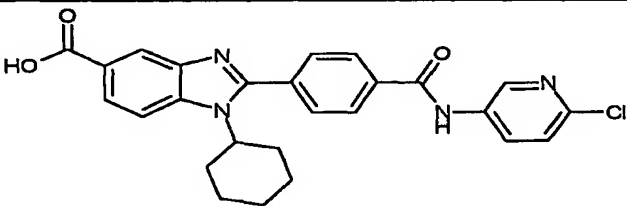
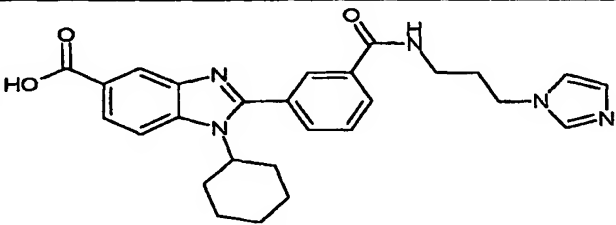
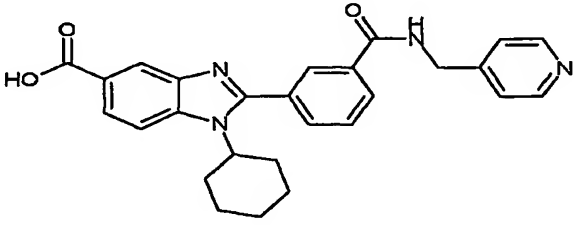
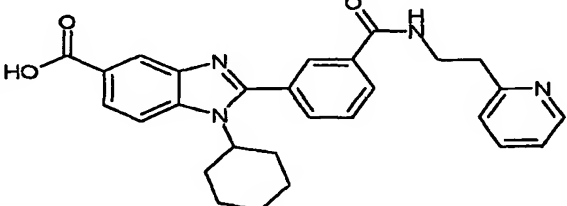
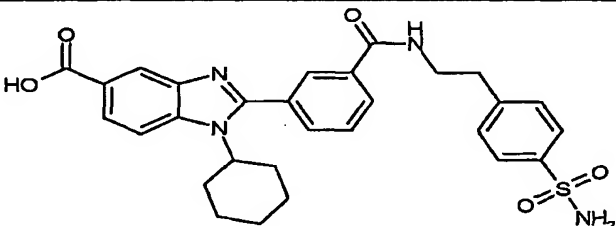
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1403 |  | 534(M+H) |
| 1404 |  | 475(M+H) |
| 1405 |  | 472(M+H) |
| 1406 |  | 455(M+H) |
| 1407 |  | 469(M+H) |
| 1408 |  | 547(M+H) |

表146

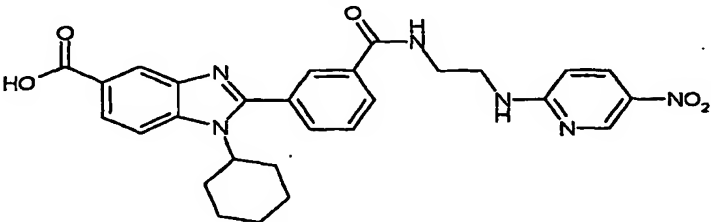
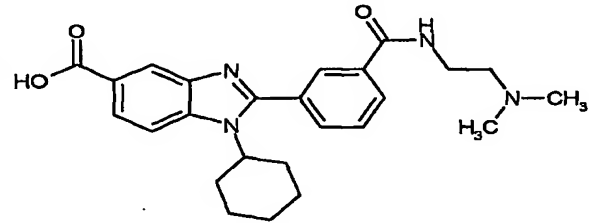
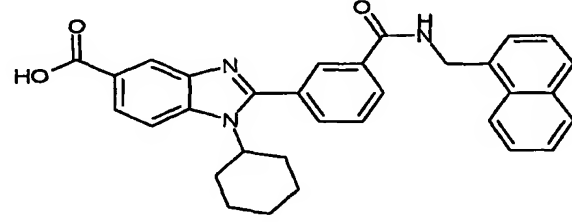
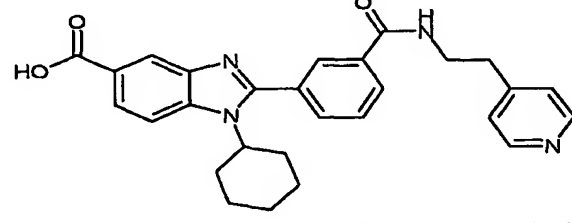
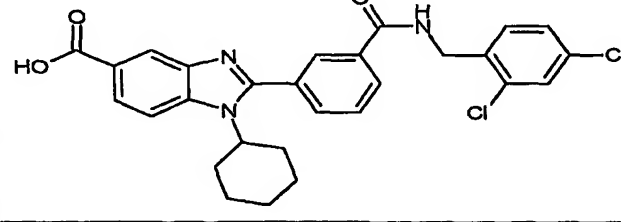
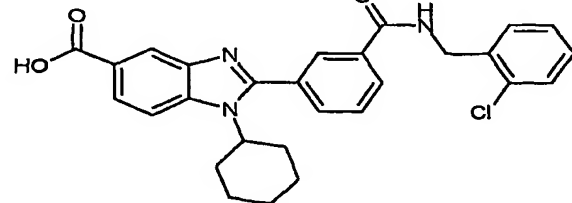
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1409 |  | 529(M+H) |
| 1410 |  | 435(M+H) |
| 1411 |  | 504(M+H) |
| 1412 |  | 469(M+H) |
| 1413 |  | 522(M+H) |
| 1414 |  | 488(M+H) |

表147

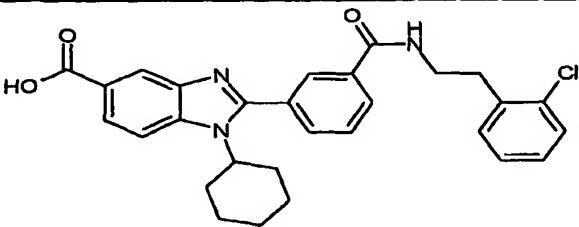
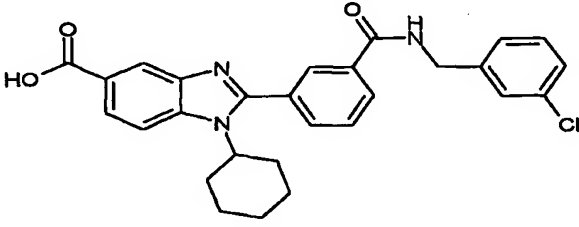
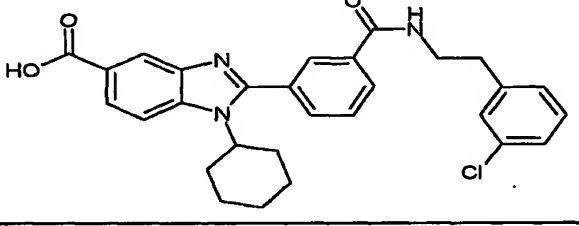
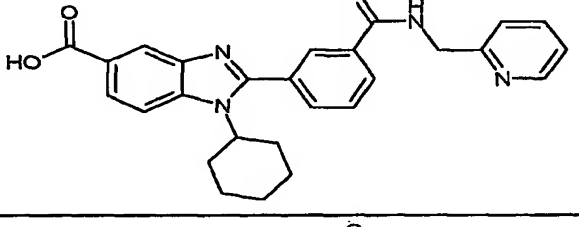
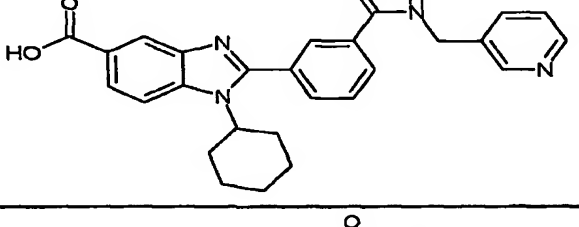
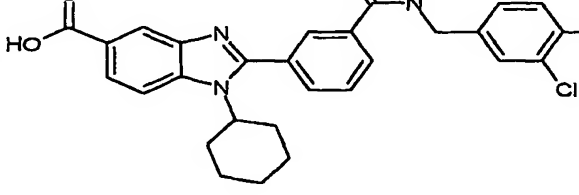
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1415 |  | 502(M+H) |
| 1416 |  | 488(M+H) |
| 1417 |  | 502(M+H) |
| 1418 |  | 455(M+H) |
| 1419 |  | 455(M+H) |
| 1420 |  | 522(M+H) |

表148

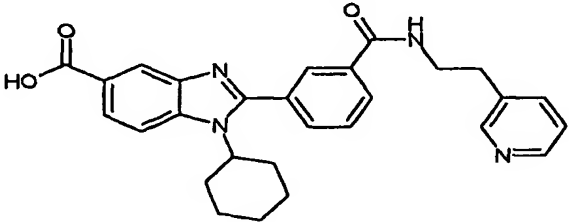
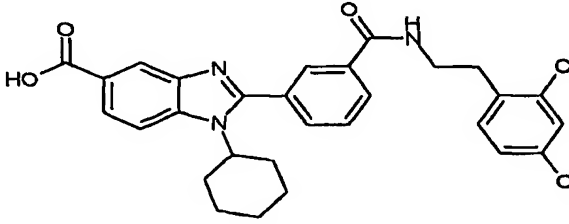
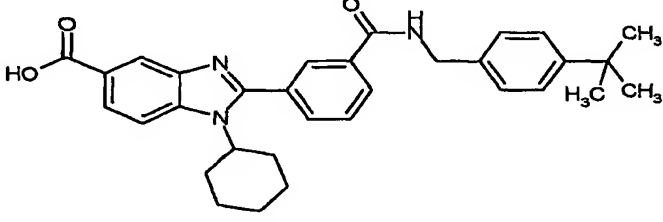
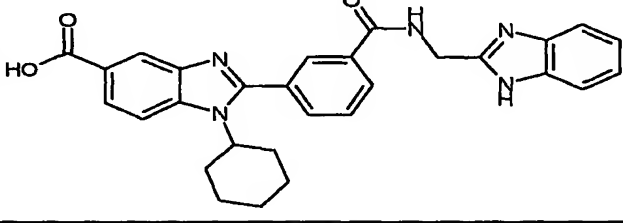
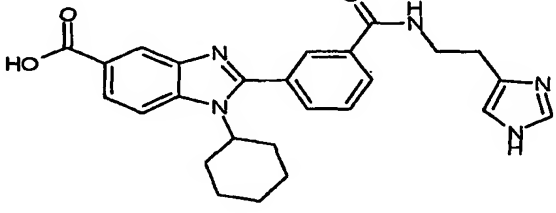
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1421 |  | 469(M+H) |
| 1422 |  | 536(M+H) |
| 1423 |  | 510(M+H) |
| 1424 |  | 494(M+H) |
| 1425 |  | 458(M+H) |

表149

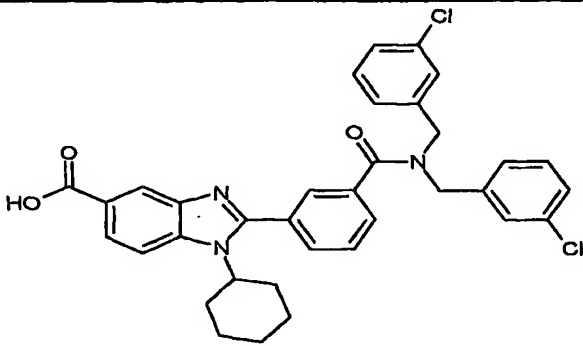
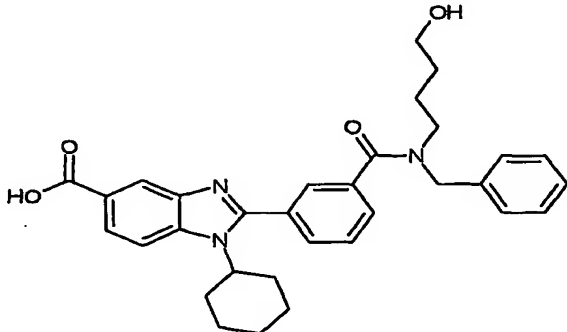
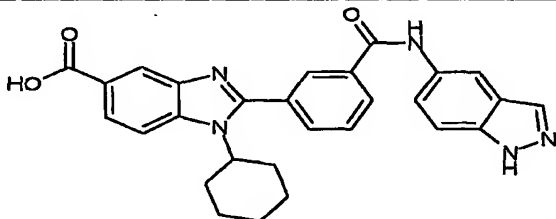
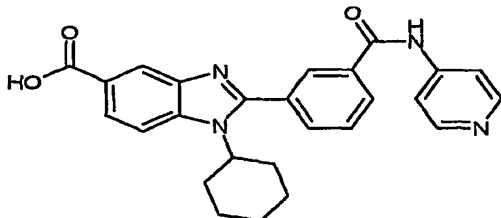
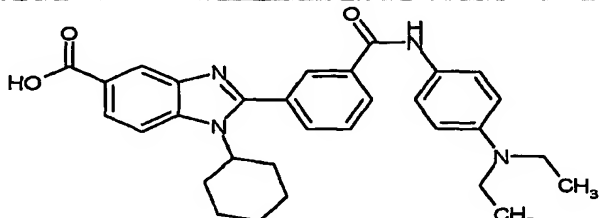
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1426 |  | 612(M+H) |
| 1427 |  | 526(M+H) |
| 1428 |  | 480(M+H) |
| 1429 |  | 441(M+H) |
| 1430 |  | 511(M+H) |

表150

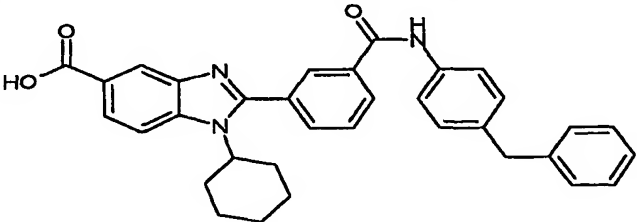
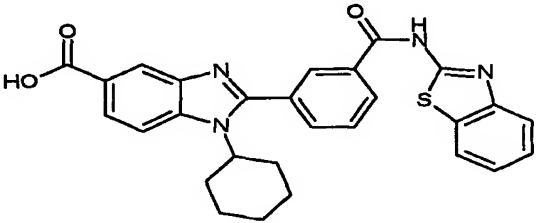
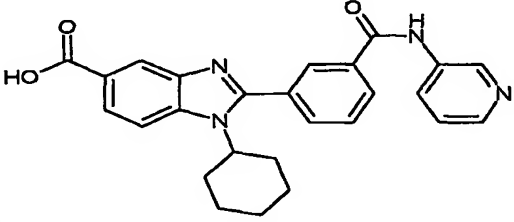
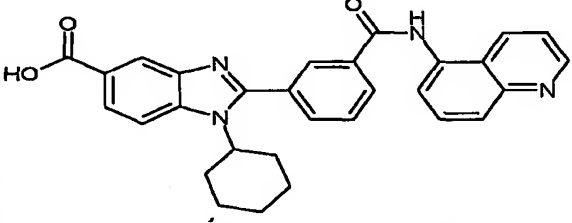
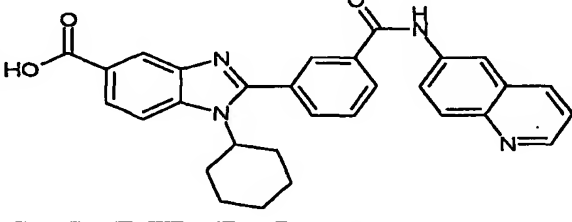
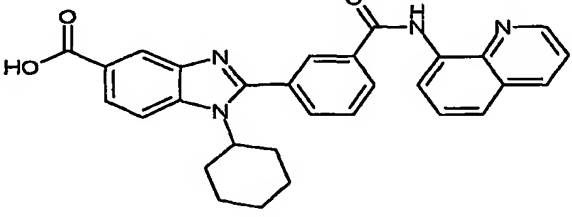
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1431 |  | 530(M+H) |
| 1432 |  | 497(M+H) |
| 1433 |  | 441(M+H) |
| 1434 |  | 491(M+H) |
| 1435 |  | 491(M+H) |
| 1436 |  | 491(M+H) |

表151

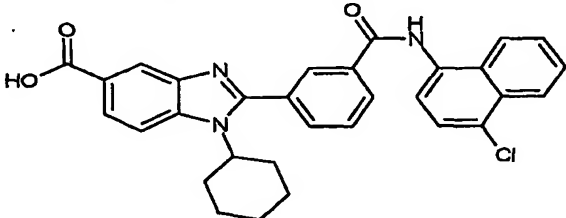
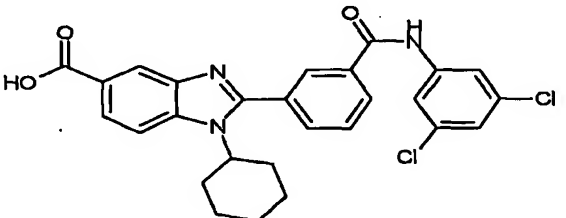
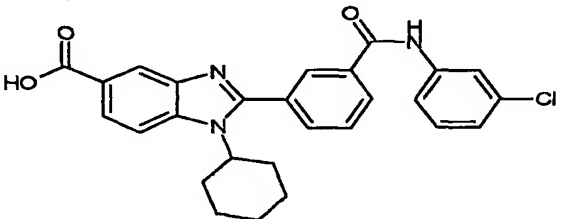
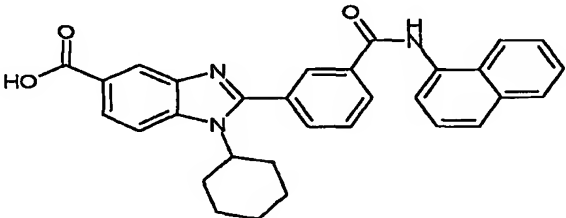
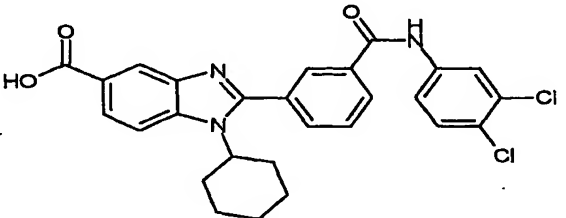
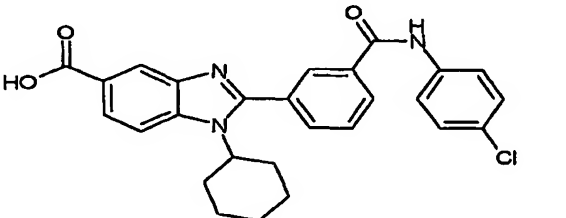
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1437 |  | 524(M+H) |
| 1438 |  | 508(M+H) |
| 1439 |  | 474(M+H) |
| 1440 |  | 490(M+H) |
| 1441 |  | 508(M+H) |
| 1442 |  | 474(M+H) |

表152

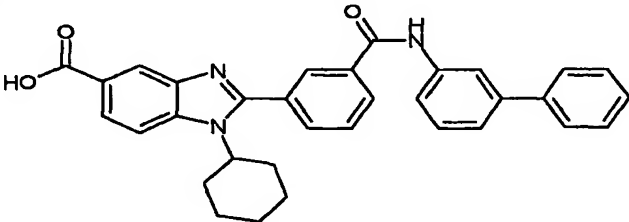
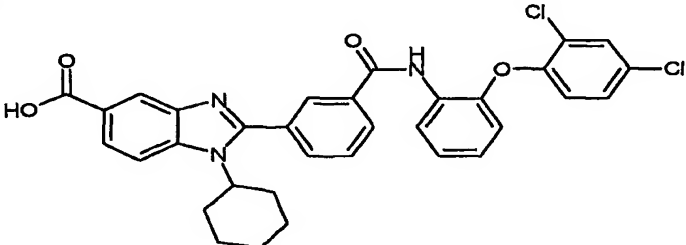
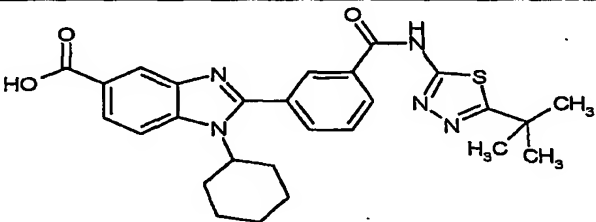
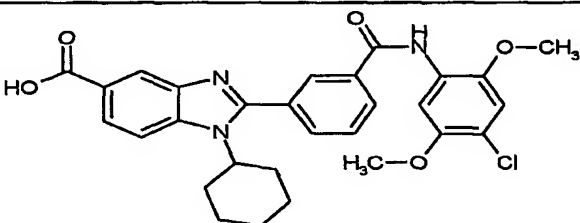
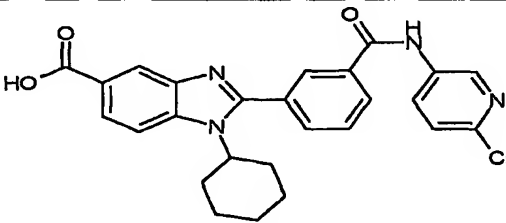
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1443 |  | 516(M+H) |
| 1444 |  | 600(M+H) |
| 1445 |  | 504(M+H) |
| 1446 |  | 534(M+H) |
| 1447 |  | 475(M+H) |

表153

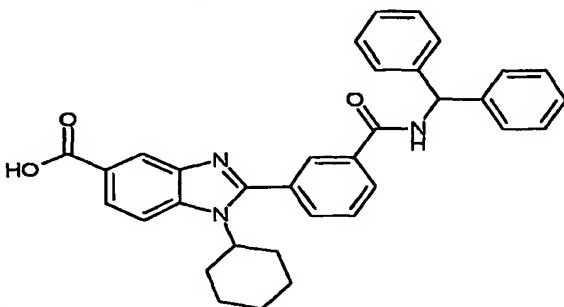
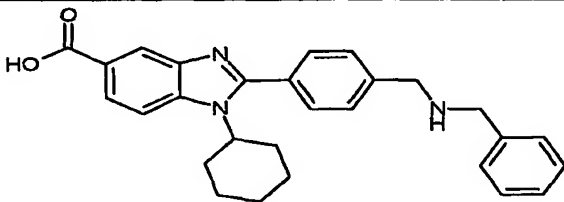
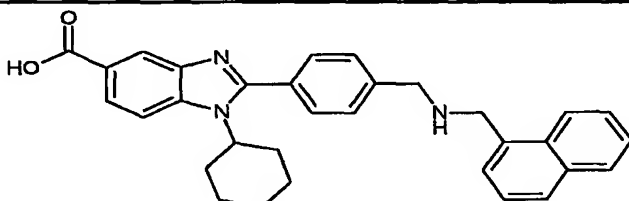
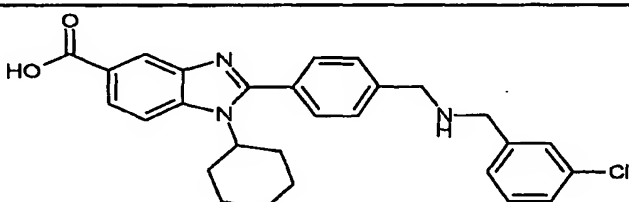
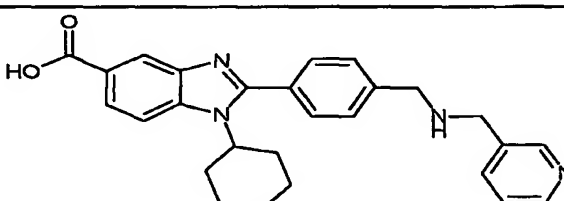
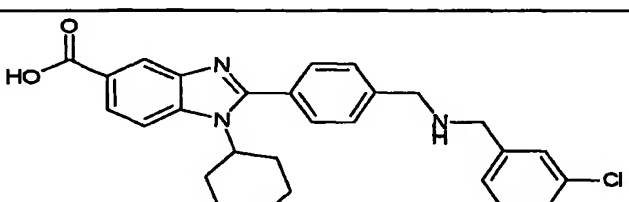
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1448 |  | 530(M+H) |
| 1449 |  | 440(M+H) |
| 1450 |  | 490(M+H) |
| 1451 |  | 474(M+H) |
| 1452 |  | 441(M+H) |
| 1453 |  | 508(M+H) |

表154

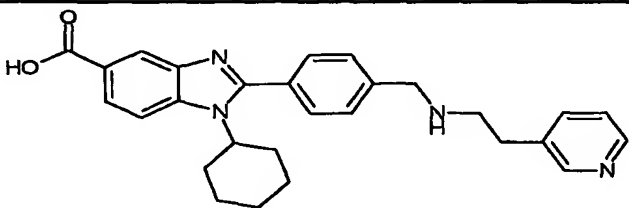
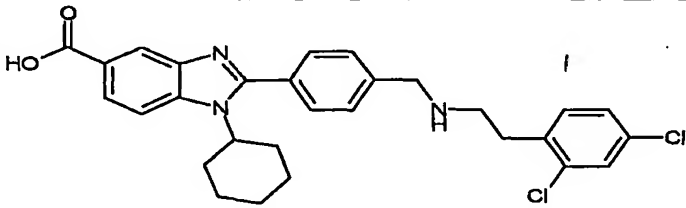
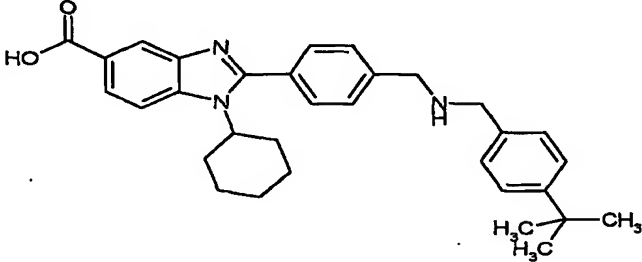
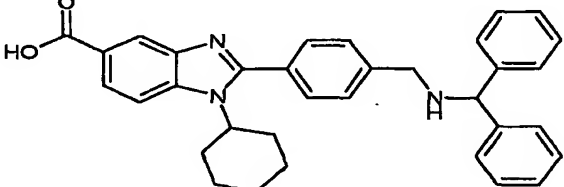
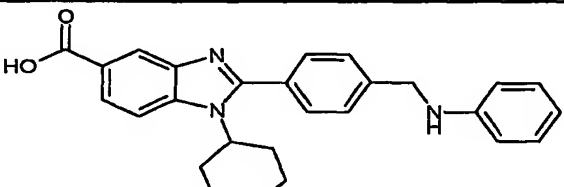
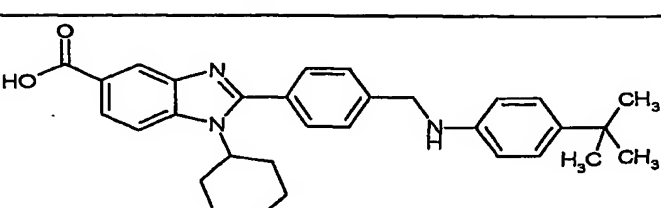
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1454 |  | 455(M+H) |
| 1455 |  | 522(M+H) |
| 1456 |  | 496(M+H) |
| 1457 |  | 516(M+H) |
| 1458 |  | 426(M+H) |
| 1459 |  | 482(M+H) |

表155

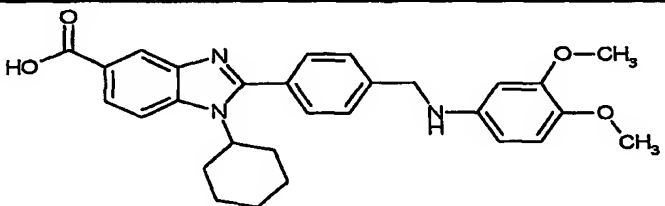
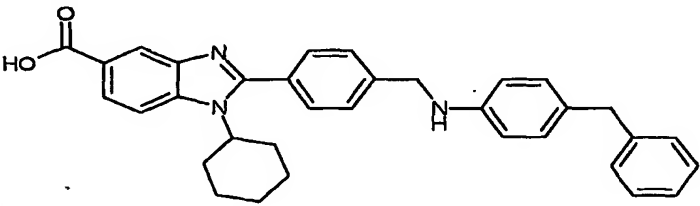
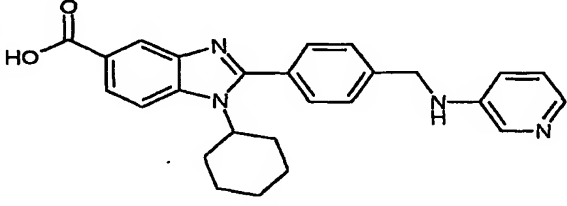
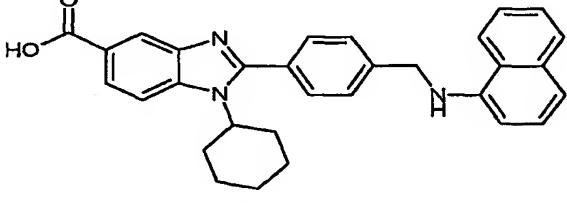
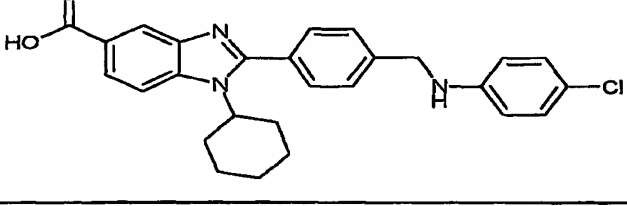
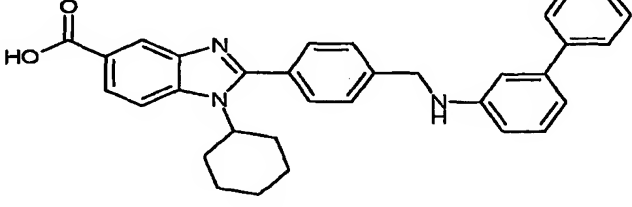
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1460 |  | 486(M+H) |
| 1461 |  | 516(M+H) |
| 1462 |  | 427(M+H) |
| 1463 |  | 476(M+H) |
| 1464 |  | 460(M+H) |
| 1465 |  | 502(M+H) |

表156

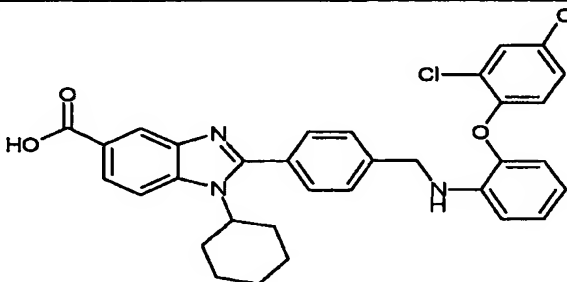
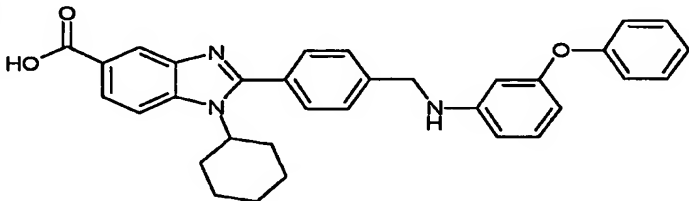
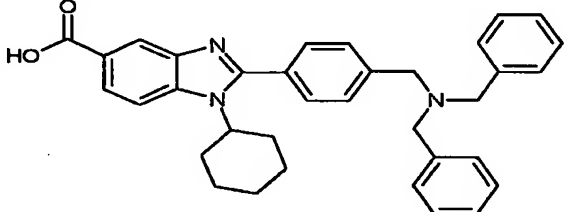
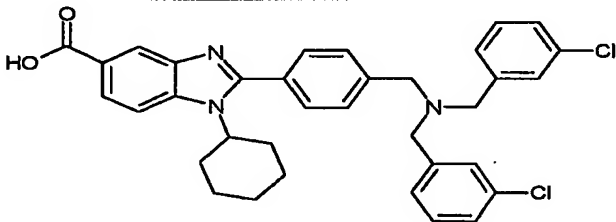
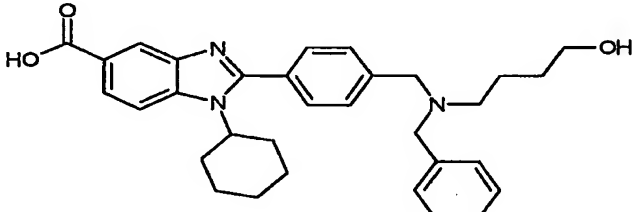
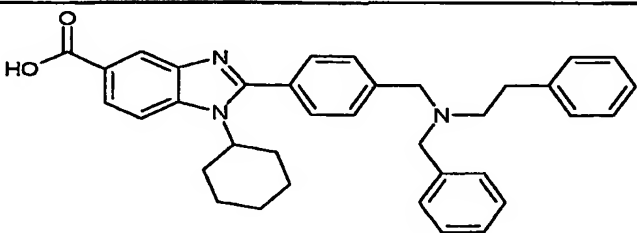
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1466 |  | 586(M+H) |
| 1467 |  | 518(M+H) |
| 1468 |  | 530(M+H) |
| 1469 |  | 598(M+H) |
| 1470 |  | 512(M+H) |
| 1471 |  | 544(M+H) |

表157

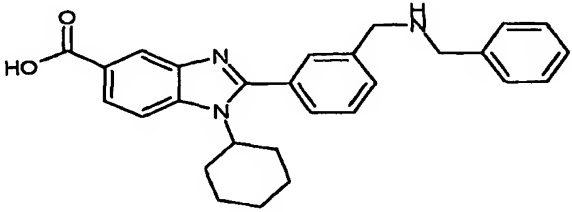
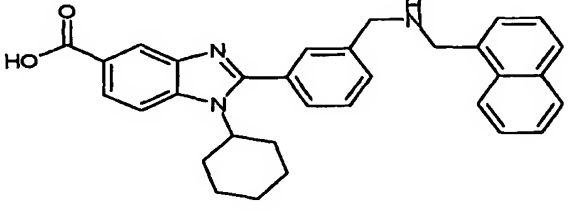
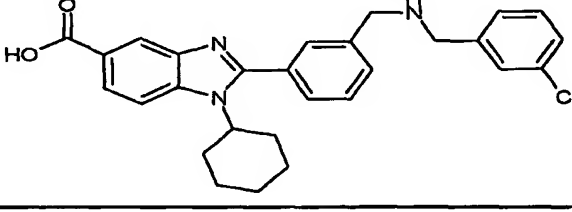
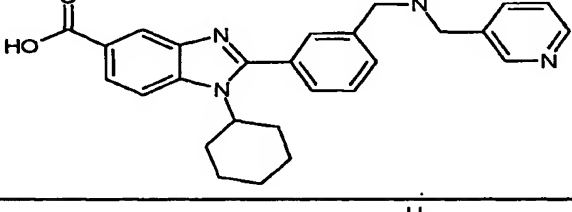
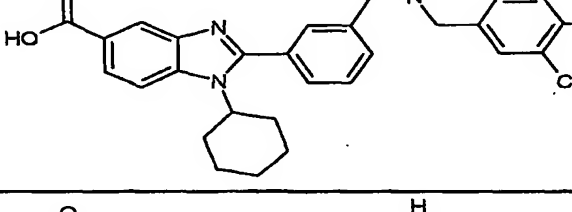
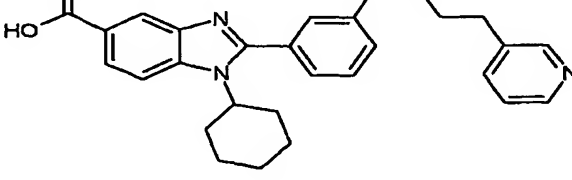
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1472 |  | 440(M+H) |
| 1473 |  | 490(M+H) |
| 1474 |  | 474(M+H) |
| 1475 |  | 441(M+H) |
| 1476 |  | 508(M+H) |
| 1477 |  | 455(M+H) |

表158

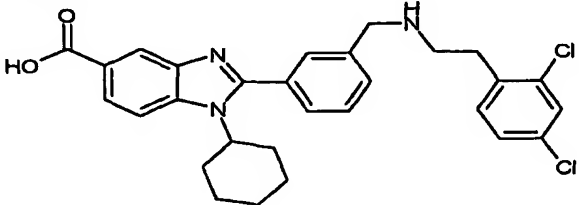
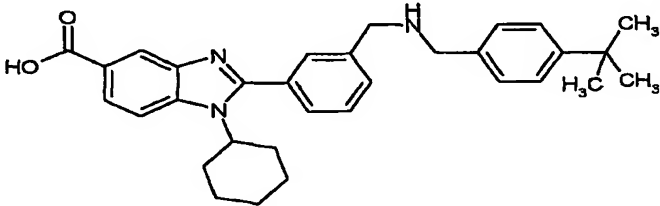
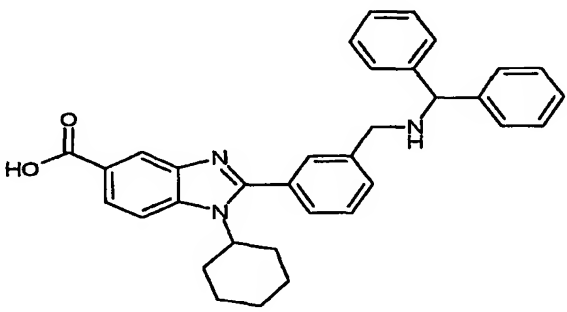
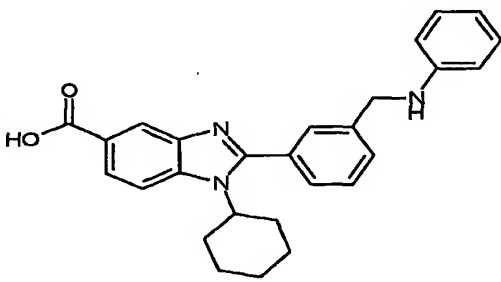
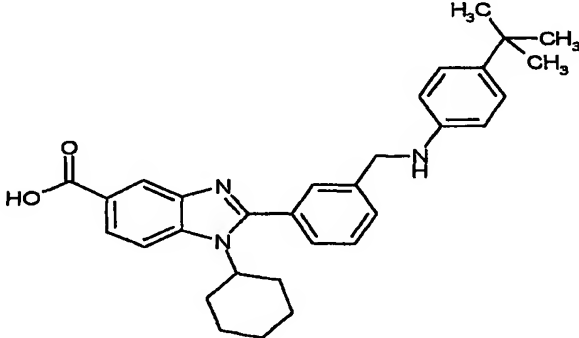
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1478 |  | 522(M+H) |
| 1479 |  | 496(M+H) |
| 1480 |  | 516(M+H) |
| 1481 |  | 426(M+H) |
| 1482 |  | 482(M+H) |

表159

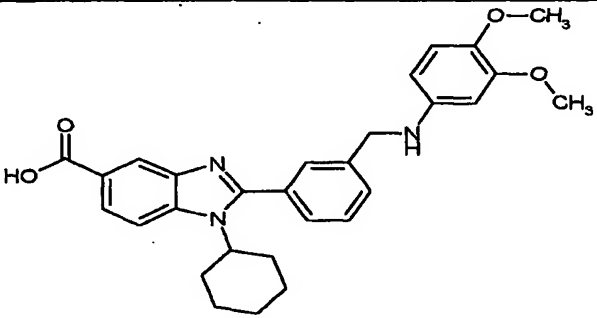
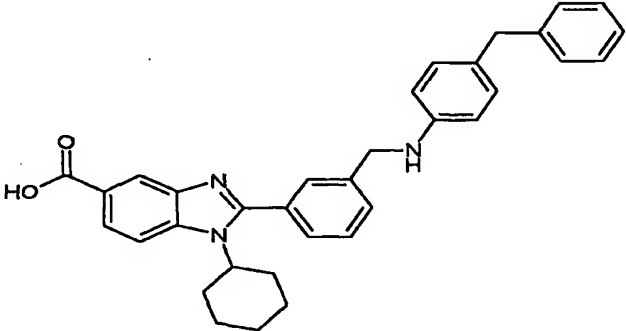
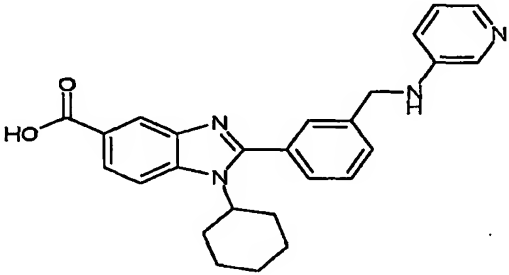
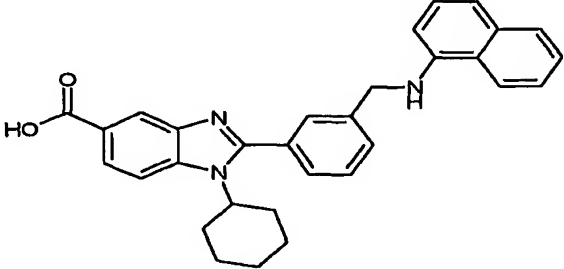
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1483 |  | 486(M+H) |
| 1484 |  | 516(M+H) |
| 1485 |  | 427(M+H) |
| 1486 |  | 476(M+H) |

表160

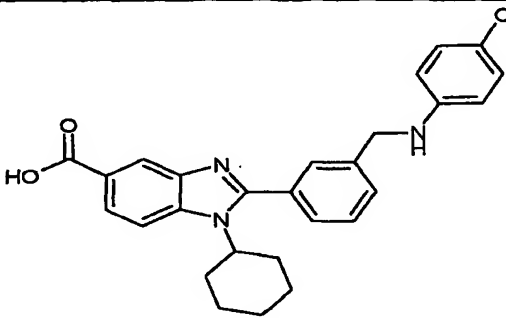
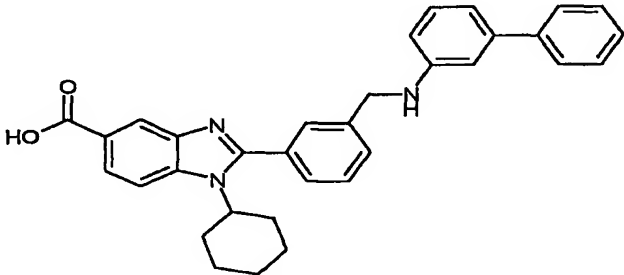
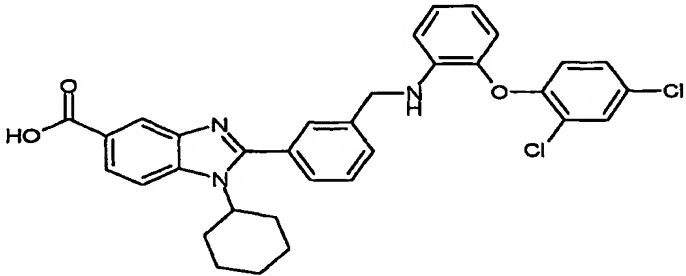
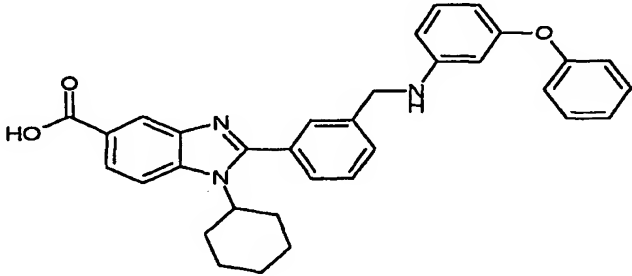
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1487 |  | 460(M+H) |
| 1488 |  | 502(M+H) |
| 1489 |  | 586(M+H) |
| 1490 |  | 518(M+H) |

表161

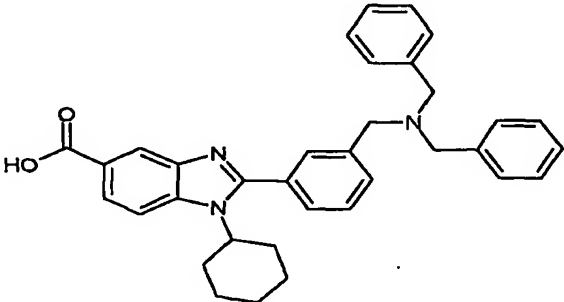
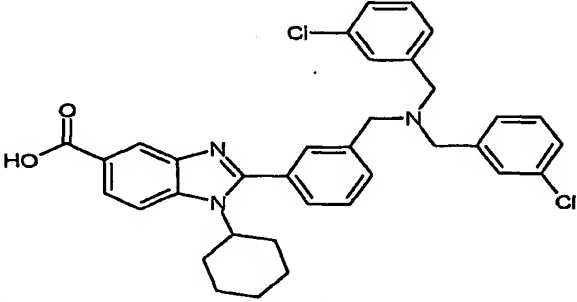
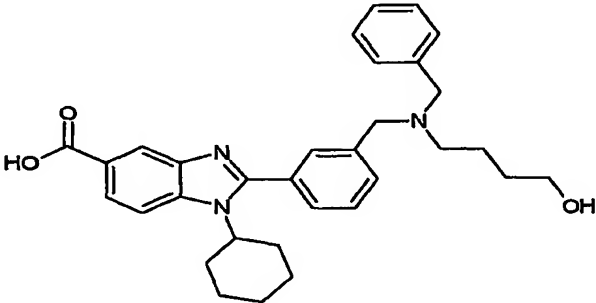
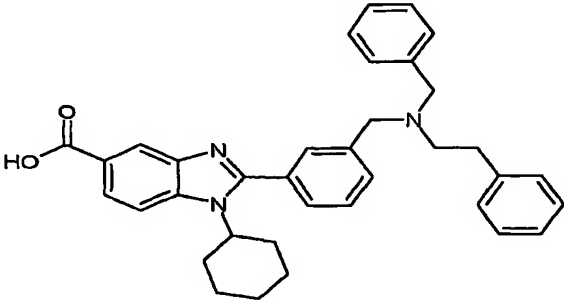
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1491 |  | 530(M+H) |
| 1492 |  | 598(M+H) |
| 1493 |  | 512(M+H) |
| 1494 |  | 544(M+H) |

表162

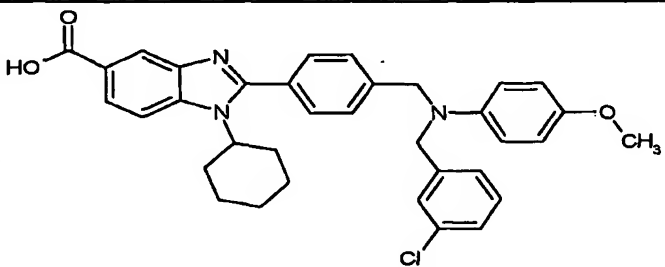
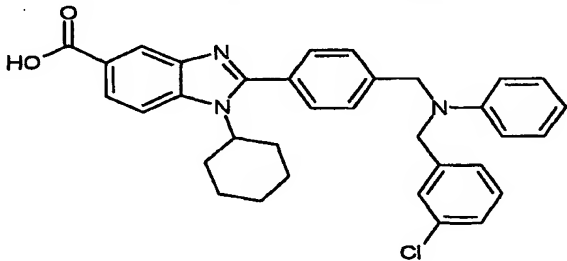
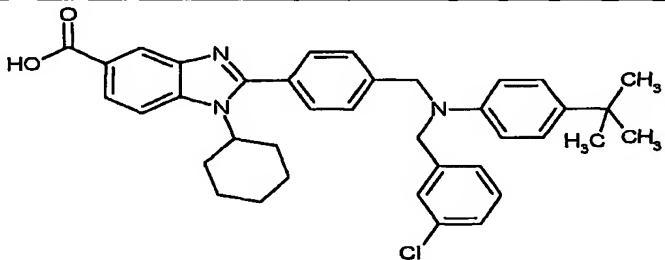
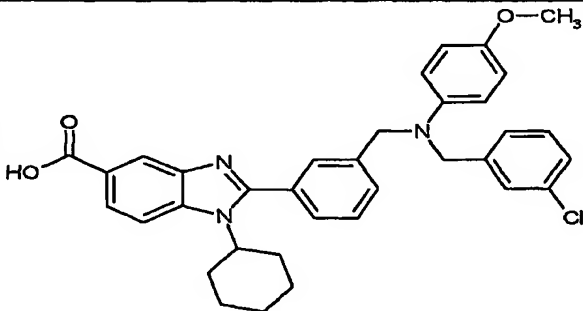
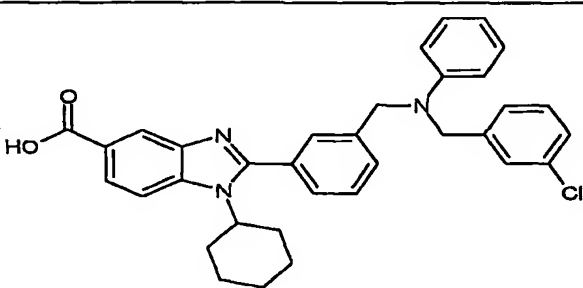
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1495 |  | 580(M+H) |
| 1496 |  | 550(M+H) |
| 1497 |  | 606(M+H) |
| 1498 |  | 580(M+H) |
| 1499 |  | 550(M+H) |

表163

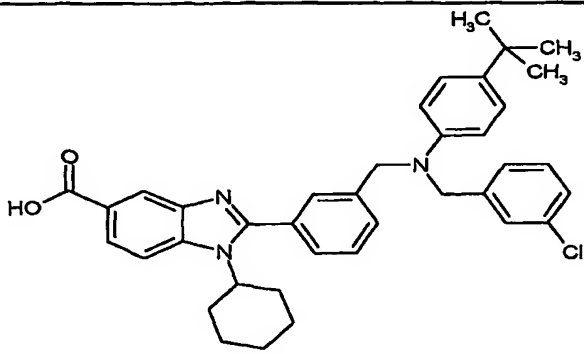
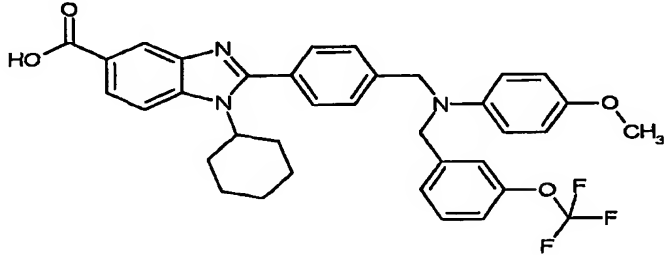
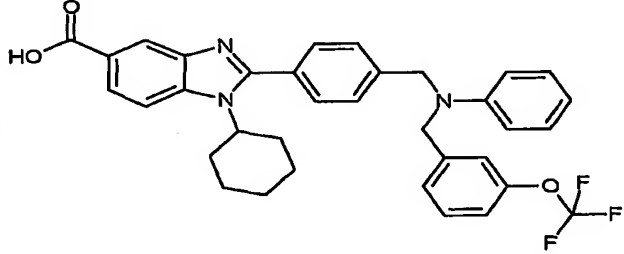
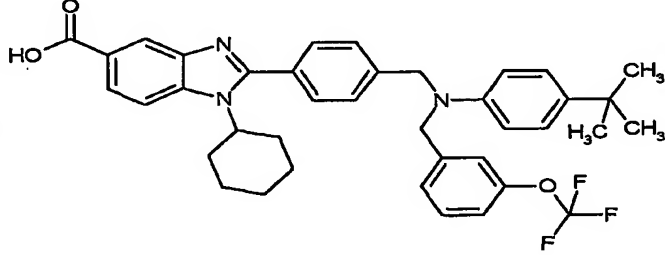
| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1500 |  | 606(M+H) |
| 1501 |  | 630(M+H) |
| 1502 |  | 600(M+H) |
| 1503 |  | 656(M+H) |

表164

| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1504 | <chem>COc1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C3=NC4=CC=C(C(=O)O)C5=C4N(C6CCCCC6)C5=C3)c7ccc(cc7)OC(F)(F)F</chem> | 630(M+H) |
| 1505 | <chem>c1ccccc1CN(Cc2ccc(cc2)C3=NC4=CC=C(C(=O)O)C5=C4N(C6CCCCC6)C5=C3)c7ccc(cc7)Oc8ccccc8</chem> | 600(M+H) |
| 1506 | <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C3=NC4=CC=C(C(=O)O)C5=C4N(C6CCCCC6)C5=C3)c7ccc(cc7)OC(F)(F)F</chem> | 656(M+H) |
| 1507 | <chem>COc1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C3=NC4=CC=C(C(=O)O)C5=C4N(C6CCCCC6)C5=C3)c7ccc(cc7)Cl</chem> | 580(M+H) |

表165

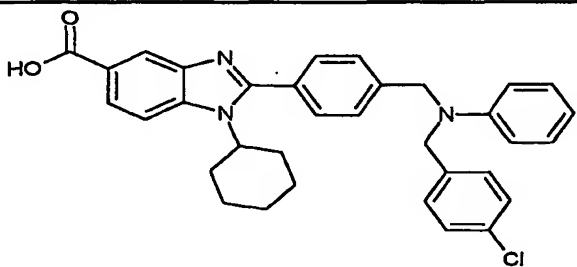
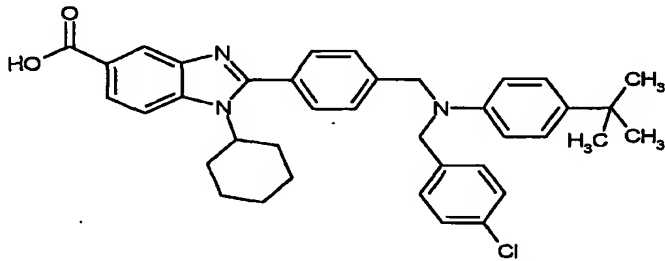
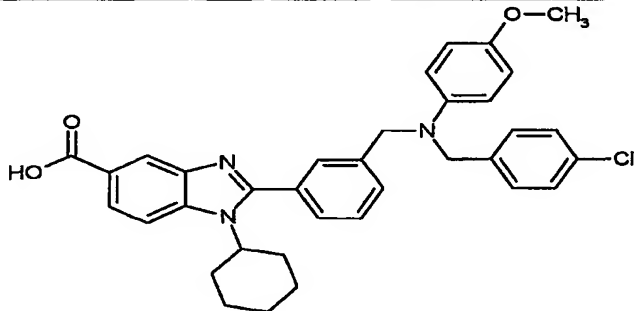
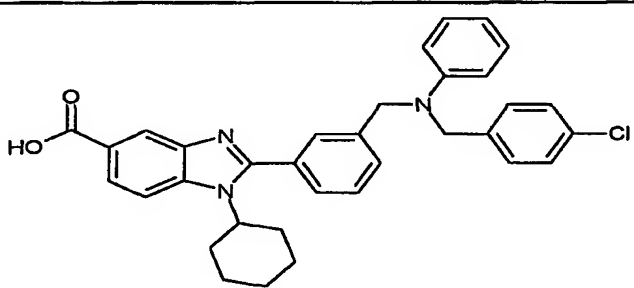
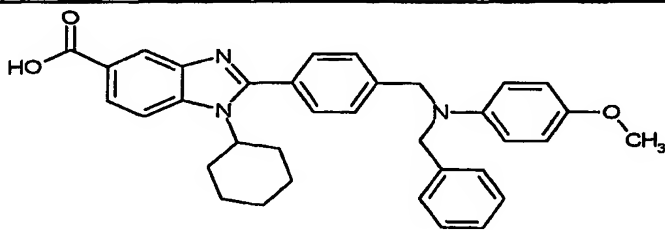
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1508 |  | 550(M+H) |
| 1509 |  | 606(M+H) |
| 1510 |  | 580(M+H) |
| 1511 |  | 550(M+H) |
| 1512 |  | 546(M+H) |

表166

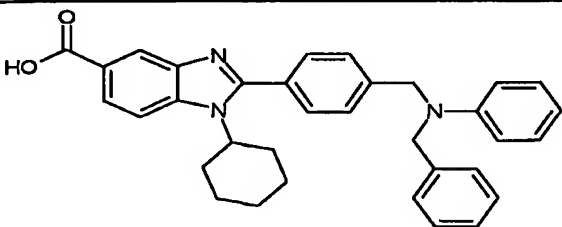
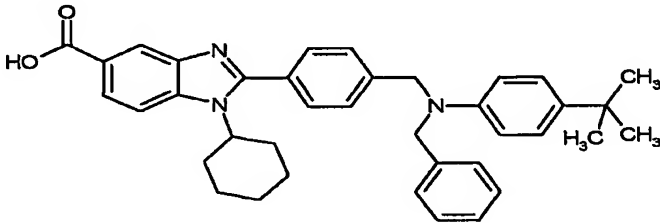
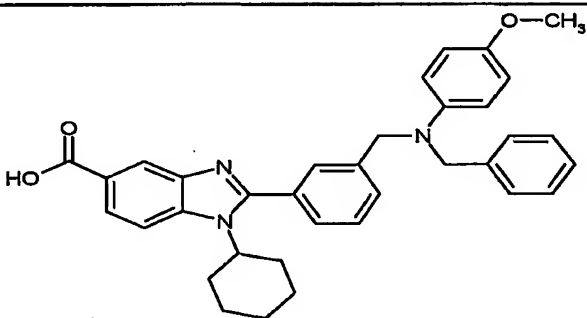
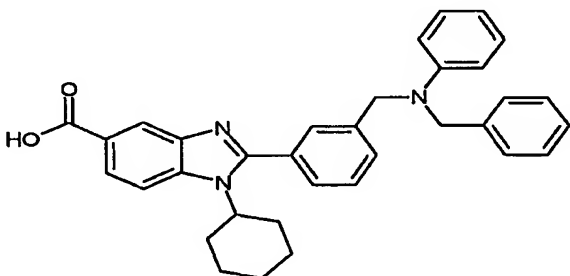
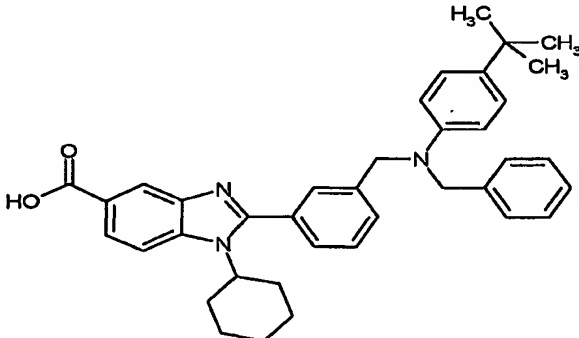
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1513 |  | 516(M+H) |
| 1514 |  | 572(M+H) |
| 1515 |  | 546(M+H) |
| 1516 |  | 516(M+H) |
| 1517 |  | 572(M+H) |

表167

| 实施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1518 | <chem>COc1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)C4=NC5=C(C(=O)O)C=CC=C5N4C6CCCCC6</chem> | 602(M+H) |
| 1519 | <chem>c1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)C4=NC5=C(C(=O)O)C=CC=C5N4C6CCCCC6</chem> | 572(M+H) |
| 1520 | <chem>Cc1ccc(cc1)C(C)(C)CN(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)C4=NC5=C(C(=O)O)C=CC=C5N4C6CCCCC6</chem> | 628(M+H) |
| 1521 | <chem>Clc1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)C4=NC5=C(C(=O)O)C=CC=C5N4C6CCCCC6</chem> | 606(M+H) |

表168

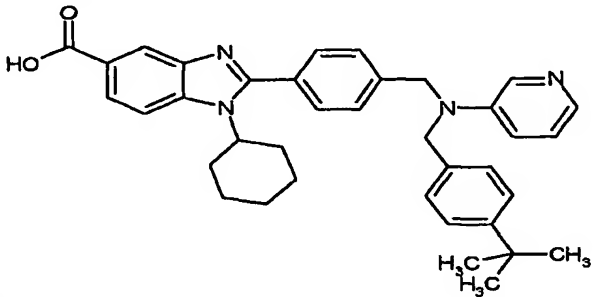
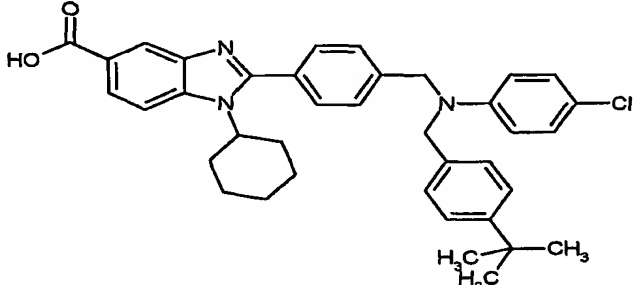
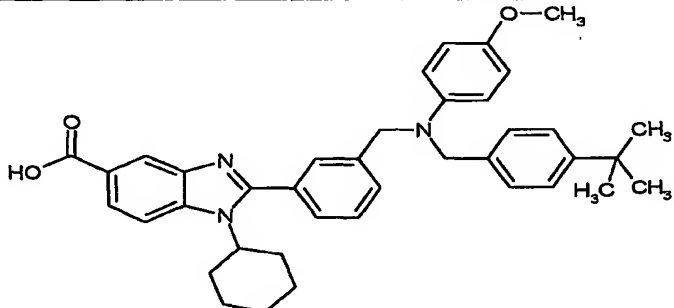
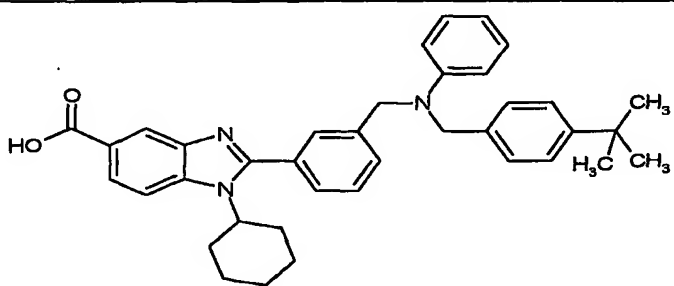
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1522 |  | 573(M+H) |
| 1523 |  | 606(M+H) |
| 1524 |  | 602(M+H) |
| 1525 |  | 572(M+H) |

表169

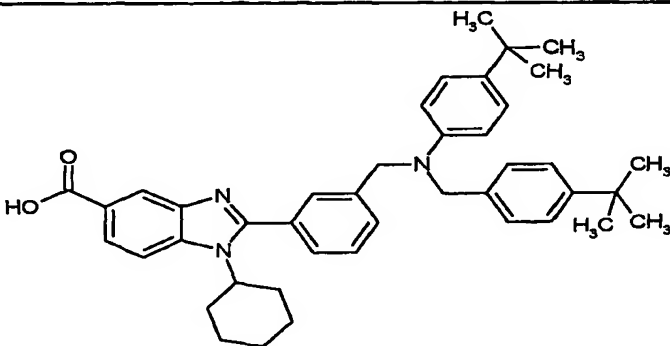
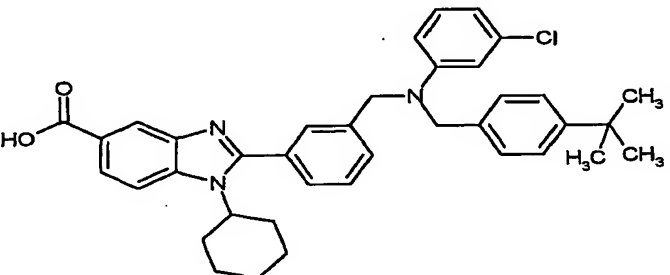
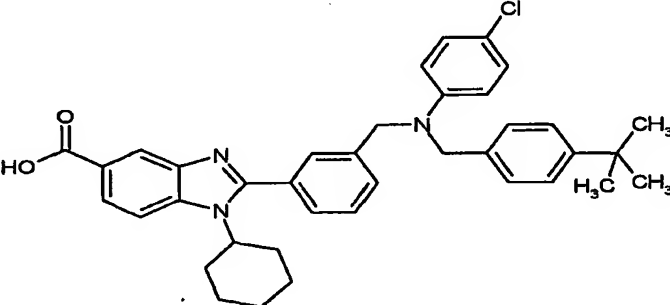
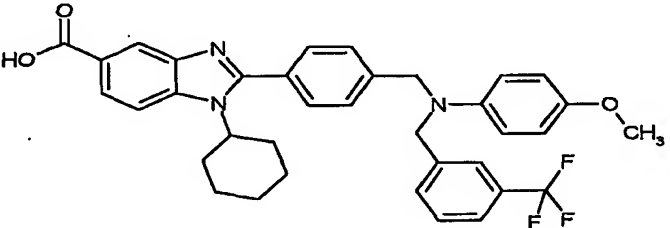
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1526 |  | 628(M+H) |
| 1527 |  | 606(M+H) |
| 1528 |  | 606(M+H) |
| 1529 |  | 614(M+H) |

表170

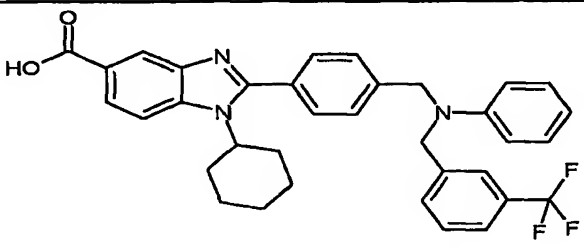
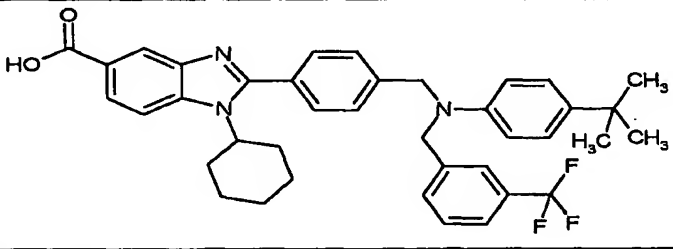
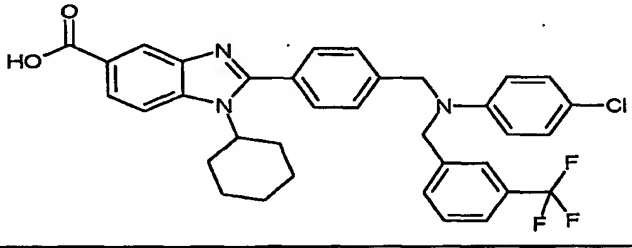
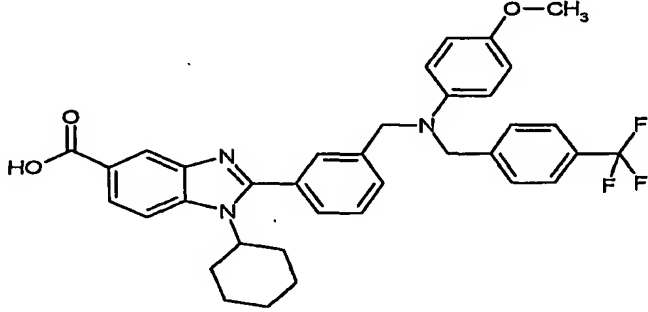
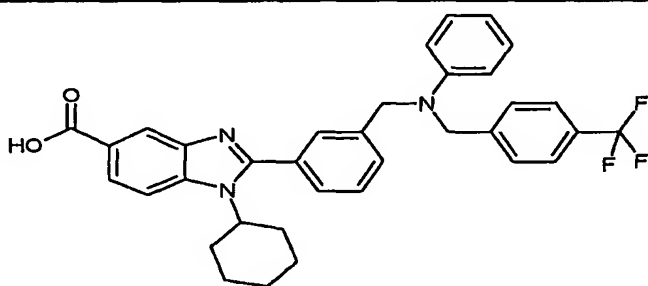
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1530 |  | 584(M+H) |
| 1531 |  | 640(M+H) |
| 1532 |  | 618(M+H) |
| 1533 |  | 614(M+H) |
| 1534 |  | 584(M+H) |

表171

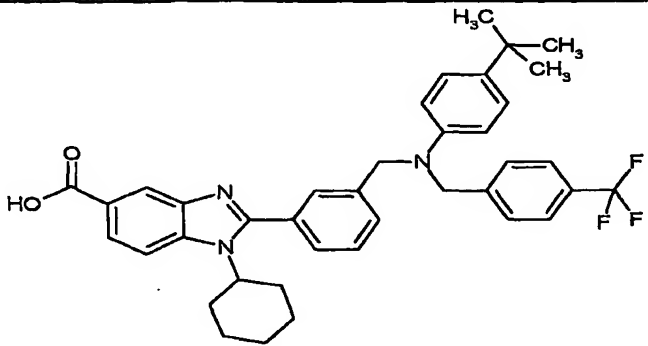
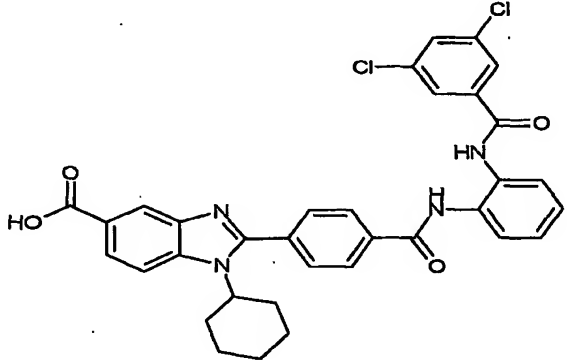
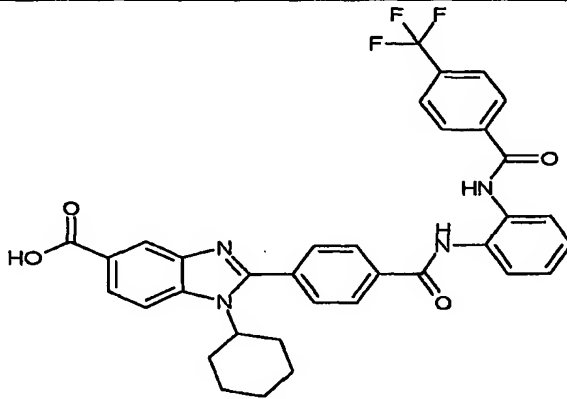
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1535 |  | 640(M+H) |
| 1536 |  | 627(M+H) |
| 1537 |  | 627(M+H) |

表172

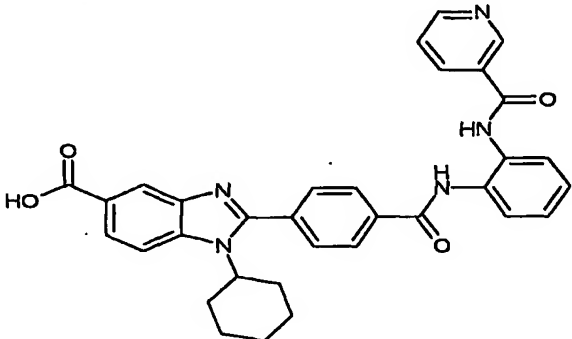
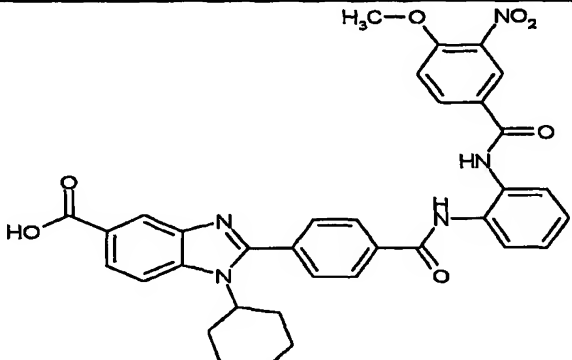
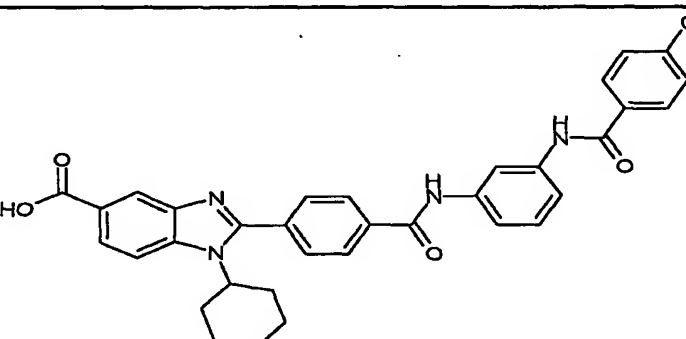
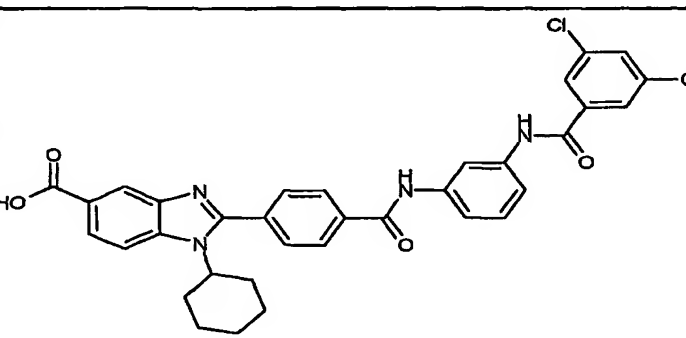
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1538 |  | 560(M+H) |
| 1539 |  | 634(M+H) |
| 1540 |  | 593(M+H) |
| 1541 |  | 627(M+H) |

表173

| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|---|----------|
| 1542 | | 627(M+H) |
| 1543 | | 560(M+H) |
| 1544 | | 634(M+H) |
| 1545 | | 593(M+H) |

表174

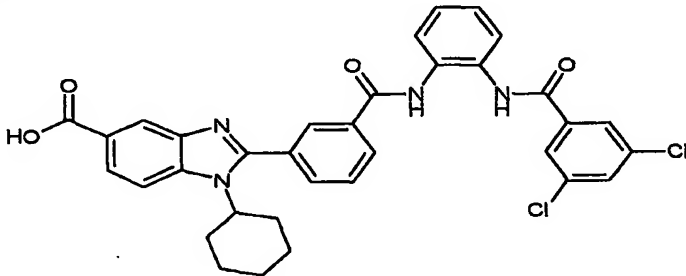
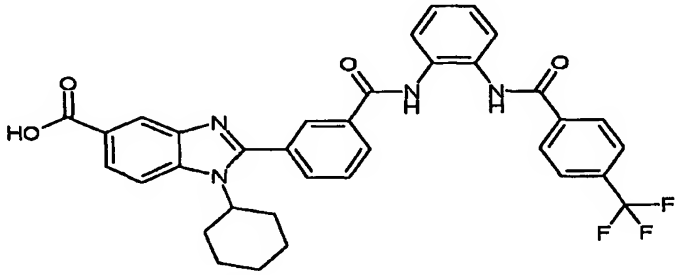
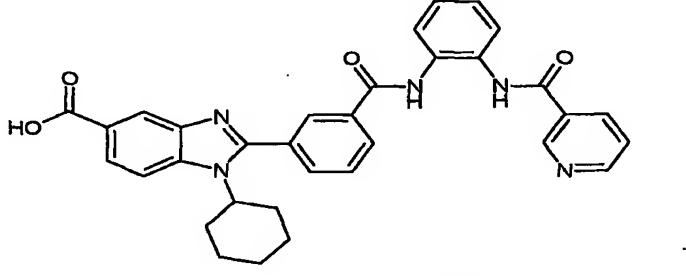
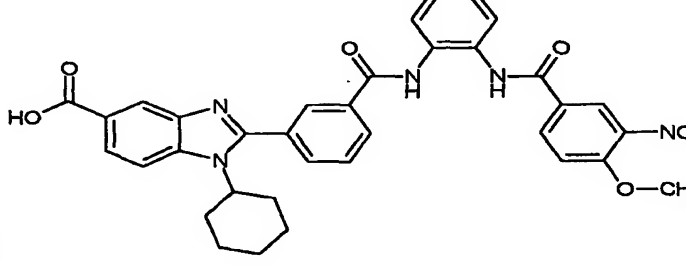
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1546 |  | 627(M+H) |
| 1547 |  | 627(M+H) |
| 1548 |  | 560(M+H) |
| 1549 |  | 634(M+H) |

表175

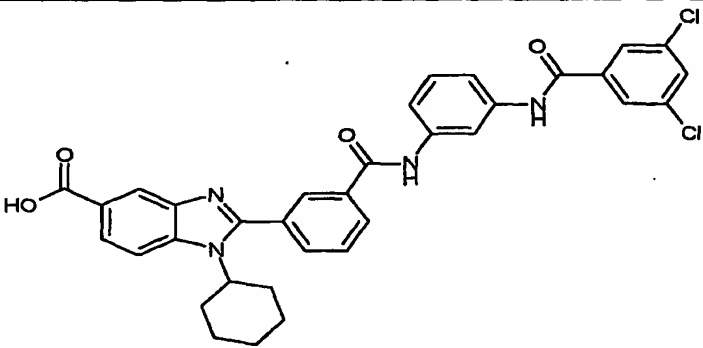
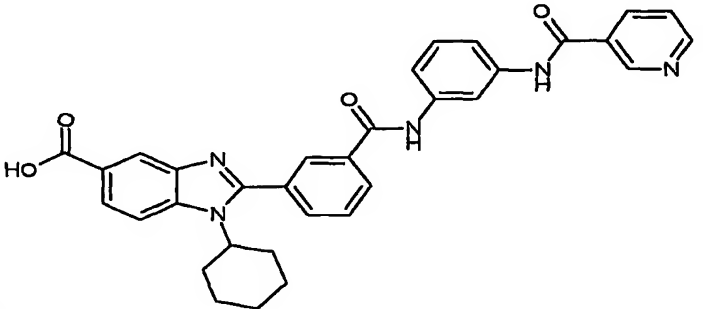
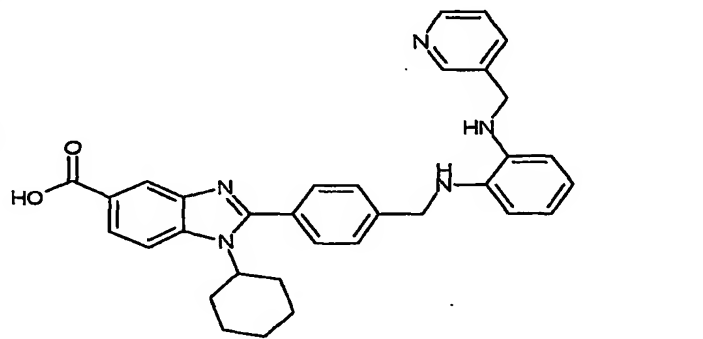
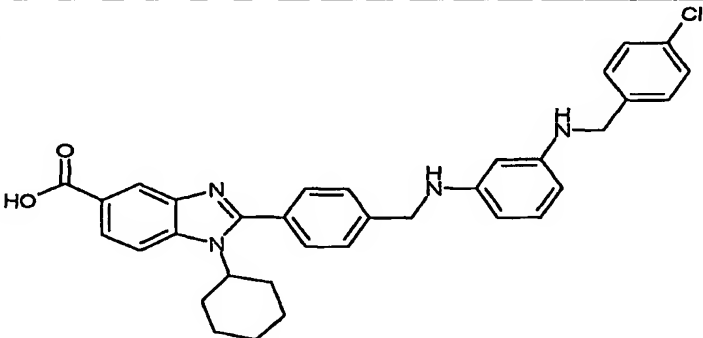
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1550 |  | 627(M+H) |
| 1551 |  | 560(M+H) |
| 1552 |  | 532(M+H) |
| 1553 |  | 565(M+H) |

表176

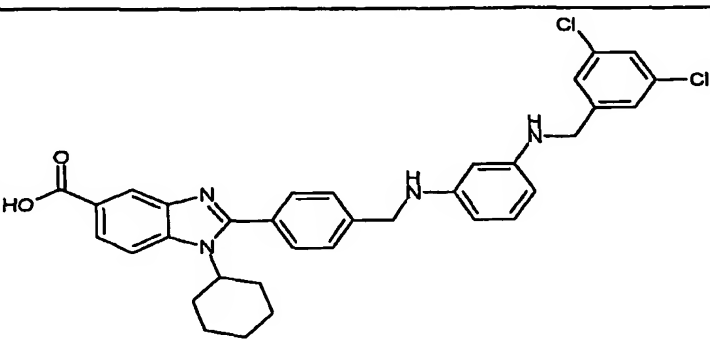
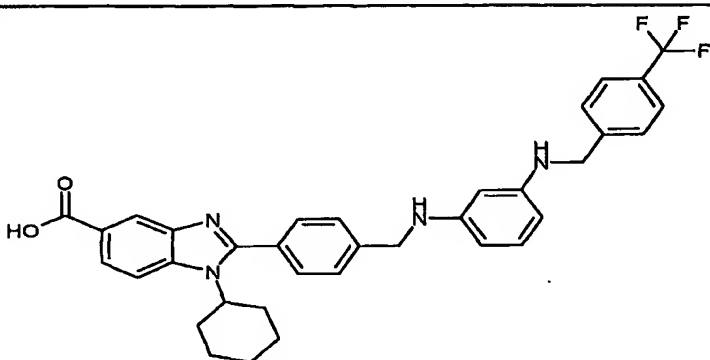
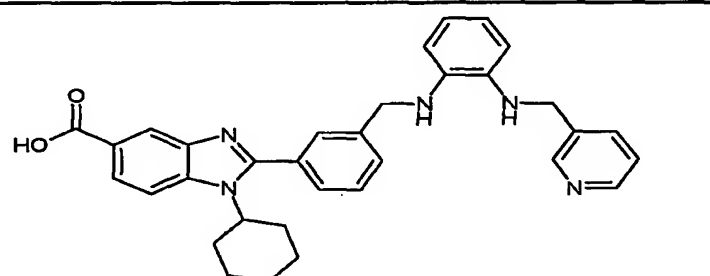
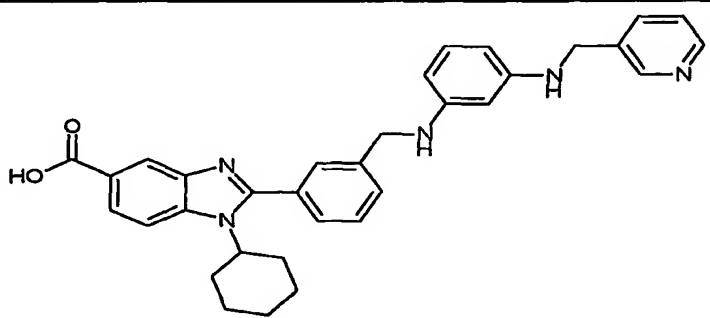
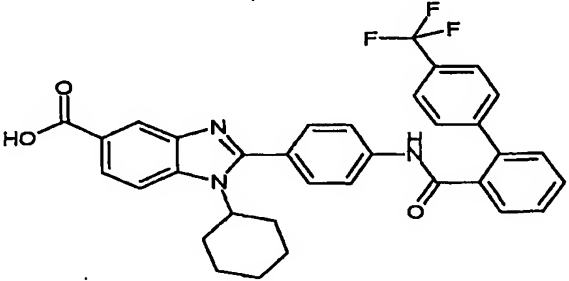
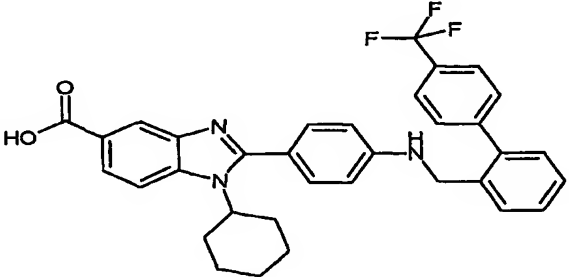
| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1554 |  | 599(M+H) |
| 1555 |  | 599(M+H) |
| 1556 |  | 532(M+H) |
| 1557 |  | 532(M+H) |

表177

| 実施例 番号 | 式 | MS |
|-----------|------------------------------------------------------------------------------------|----------|
| 1558 |  | 584(M+H) |
| 1559 |  | 570(M+H) |

次に、本発明化合物のHCVポリメラーゼ阻害活性の評価方法について説明する。当該ポリメラーゼは、HCVのRNA遺伝子上のNS5Bと呼ばれる非構造タンパク領域にコードされる酵素である(EMBO J.,15:12-22,1996)。

試験例 [I]

i) 酵素(HCVポリメラーゼ)の調製法

C型肝炎の患者血液より採取したHCV BK株の全長RNA遺伝子に対応するcDNAクローンを鋳型として、NS5B(591アミノ酸; J Virol 1991 Mar, 65(3), 1105-13)をコードする領域をPCR法により増幅した。この5'末端に6Hisタグ{連続する6つのヒスチジン(His)をコードする塩基対}を付加して得た目的遺伝子を、大腸菌に形質転換した。目的蛋白質産生大腸菌を培養した後、菌体を、界面活性剤を含む緩衝液中で懸濁し、マイクロフルイダイザーにて破碎した。次に遠心した上清を、金属キレートクロマトグラフィーを含む各種カラムクロマトグラフィー{ポリ[U]-セファロース、セファクリルS-200、モノ-S(ファルマシア社製)}で処理することにより酵素標品を得た。

ii) 基質RNAの合成

HCVゲノムの3'非翻訳領域配列をもとに設計した合成プライマーを用いて、polyU及び3'X配列を含むDNA断片(148bp)を全合成し、プラスミドpBluescript SK II(+)(Stratagene社製)にクローニングした。前記i)で調製したNS5B全長をコードするcDNAを制限酵素KpnIで消化し、該制限酵素切断部位から終止コドンまでの塩基配列からなるcDNA断片を得た。このcDNA断片をpBluescript SK II(+)(+)の3'非翻訳領域DNAの上流に挿入、接続した。この様にして挿入されたあわせて約450bpのDNA配列を基質RNA調製の鋳型とした。該プラスミドを3'X配列の直後で切断し、線状化した後、フェノール・クロロホルム処理、エタノール沈殿法により精製し、DNAを回収した。

該精製したDNAを鋳型として、pBluescript SK II(+)(+)のプロモーターを利用し、MEGAscript RNA合成キット(Ambion社製)及びT7 RNAポリメラーゼを用いてrun-off法により、RNA合成を行った(37℃、3時間)。ついで、DNase Iを加えてさらに1時間インキュベートした後、鋳型DNAを分解除去することによりRNA粗生成物を得た。該粗生成物

をフェノール・クロロホルム処理、エタノール沈殿法によって精製することにより目的の基質RNAを得た。

該RNAは、ホルムアルデヒド変性アガロースゲル電気泳動で品質を確認した後、 -80°C で保存した。

iii) 酵素 (HCVポリメラーゼ) 阻害活性の測定

被験物質 (本発明の化合物) 及び下記組成の反応液 ($30\mu\text{l}$) を、 25°C で90分間反応させた。

次いで、該反応液に 4°C の10%トリクロロ酢酸及び1%ピロリン酸ナトリウム溶液 ($150\mu\text{l}$) を加えて反応を停止させた後、氷中で15分間放置してRNAを不溶化させた。次いで該RNAを吸引濾過によりガラスフィルター (Whatman社製GF/C等) にトラップした。該フィルターを1%トリクロロ酢酸及び0.1%ピロリン酸ナトリウムからなる溶液で洗浄し、次いで90%エタノールで洗浄後、乾燥させた。液体シンチレーションカクテル (Packard社) を加え、酵素反応により合成されたRNAの放射活性を液体シンチレーションカウンターで測定した。

本発明化合物のHCVポリメラーゼ阻害活性 (IC_{50}) は、被験物質を加えた場合の酵素反応における放射活性の値と被験物質を加えない場合の酵素反応における放射活性の値から算出した。

結果を表178から表184に示す。

反応液: i) で得られたHCVポリメラーゼ ($5\mu\text{g}/\text{ml}$)、ii) で得られた基質RNA ($10\mu\text{g}/\text{ml}$)、ATP ($50\mu\text{M}$)、GTP ($50\mu\text{M}$)、CTP ($50\mu\text{M}$)、UTP ($2\mu\text{M}$)、 $[5, 6-^3\text{H}]$ UTP ($46\text{Ci}/\text{mmol}$ (Amersham社製)、 $1.5\mu\text{Ci}$) 20mM Tris-HCl ($\text{pH}7.5$)、EDTA (1mM)、 MgCl_2 (5mM)、NaCl (50mM)、DTT (1mM)、BSA (0.01%)

表 178

| 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] | 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] |
|-----------|-----------------------------------------|-----------|-----------------------------------------|
| 2 | 0.079 | 67 | 0.26 |
| 6 | 0.034 | 68 | 0.28 |
| 9 | 0.019 | 70 | 0.19 |
| 11 | 0.53 | 71 | 0.62 |
| 12 | 0.60 | 77 | 0.51 |
| 17 | 0.047 | 81 | 0.18 |
| 20 | 0.042 | 82 | 0.097 |
| 26 | 0.033 | 83 | 0.52 |
| 30 | 0.052 | 85 | 0.17 |
| 43 | 0.58 | 86 | 0.13 |
| 44 | 0.95 | 87 | 0.80 |
| 45 | 0.40 | 88 | 0.092 |
| 46 | 0.47 | 89 | 0.34 |
| 47 | 0.54 | 90 | 0.20 |
| 48 | 0.44 | 91 | 0.53 |
| 49 | 0.94 | 93 | 0.16 |
| 50 | 0.54 | 94 | 0.084 |
| 51 | 1.0 | 96 | 0.25 |
| 54 | 0.56 | 97 | 0.16 |
| 55 | 0.36 | 98 | 0.30 |

表 179

| 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] | 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] |
|-----------|-----------------------------------------|-----------|-----------------------------------------|
| 99 | 0.53 | 120 | 0.16 |
| 100 | 0.78 | 121 | 0.19 |
| 101 | 0.14 | 122 | 0.51 |
| 103 | 0.17 | 123 | 0.10 |
| 104 | 0.073 | 124 | 0.091 |
| 105 | 0.076 | 125 | 0.12 |
| 106 | 0.40 | 128 | 0.14 |
| 107 | 0.11 | 129 | 0.12 |
| 108 | 0.21 | 130 | 0.16 |
| 109 | 0.11 | 131 | 0.046 |
| 110 | 0.24 | 132 | 0.055 |
| 111 | 0.14 | 133 | 0.12 |
| 112 | 0.11 | 134 | 0.071 |
| 113 | 0.071 | 139 | 0.26 |
| 114 | 0.56 | 140 | 0.11 |
| 115 | 0.17 | 141 | 0.43 |
| 116 | 0.37 | 142 | 0.055 |
| 117 | 0.075 | 143 | 0.053 |
| 118 | 0.14 | 144 | 0.19 |
| 119 | 0.13 | 145 | 0.088 |

表 180

| 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] | 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] |
|-----------|-----------------------------------------|-----------|-----------------------------------------|
| 146 | 0.043 | 167 | 0.033 |
| 147 | 0.31 | 168 | 0.078 |
| 148 | 0.038 | 169 | 0.15 |
| 149 | 0.15 | 170 | 0.048 |
| 150 | 0.24 | 171 | 0.050 |
| 151 | 0.20 | 172 | 0.10 |
| 153 | 0.19 | 173 | 0.14 |
| 154 | 0.076 | 174 | 0.030 |
| 155 | 0.53 | 175 | 0.29 |
| 156 | 0.23 | 176 | 0.053 |
| 157 | 0.16 | 177 | 0.077 |
| 158 | 0.11 | 178 | 0.052 |
| 159 | 0.13 | 179 | 0.63 |
| 160 | 0.24 | 180 | 0.11 |
| 161 | 0.062 | 181 | 0.71 |
| 162 | 0.43 | 182 | 0.021 |
| 163 | 0.15 | 183 | 0.017 |
| 164 | 0.16 | 184 | 0.018 |
| 165 | 0.58 | 185 | 0.11 |
| 166 | 0.055 | 186 | 0.37 |

表 181

| 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] | 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] |
|-----------|-----------------------------------------|-----------|-----------------------------------------|
| 187 | 0.056 | 207 | 0.081 |
| 188 | 0.038 | 208 | 0.039 |
| 189 | 0.017 | 209 | 0.12 |
| 190 | 0.020 | 210 | 0.31 |
| 191 | 0.43 | 211 | 0.059 |
| 192 | 0.22 | 212 | 0.23 |
| 193 | 0.13 | 213 | 0.10 |
| 194 | 0.52 | 214 | 0.059 |
| 195 | 0.023 | 215 | 0.078 |
| 196 | 0.20 | 216 | 0.084 |
| 197 | 0.11 | 217 | 0.058 |
| 198 | 0.044 | 218 | 0.033 |
| 199 | 0.11 | 219 | 0.13 |
| 200 | 0.10 | 220 | 0.073 |
| 201 | 0.14 | 221 | 0.058 |
| 202 | 0.095 | 222 | 0.041 |
| 203 | 0.063 | 223 | 0.21 |
| 204 | 0.16 | 225 | 0.014 |
| 205 | 0.077 | 227 | 0.045 |
| 206 | 0.05 | 228 | 0.18 |

表 182

| 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] | 実施例 番号 | HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC_{50} [μM] |
|-----------|-----------------------------------------|-----------|-----------------------------------------|
| 229 | 0.022 | 257 | 0.074 |
| 230 | 0.17 | 259 | 0.10 |
| 231 | 0.073 | 260 | 0.27 |
| 232 | 0.015 | 262 | 0.013 |
| 233 | 0.028 | 263 | 0.035 |
| 234 | 0.022 | 264 | <0.01 |
| 235 | 0.036 | 265 | 0.014 |
| 236 | 0.075 | 266 | 0.018 |
| 237 | 0.015 | 267 | 0.014 |
| 238 | 0.19 | 268 | 0.012 |
| 239 | 0.17 | 269 | 0.013 |
| 240 | 0.055 | 270 | 0.012 |
| 248 | 0.012 | 271 | 0.024 |
| 249 | 0.022 | 272 | 0.066 |
| 250 | 0.018 | 273 | 0.041 |
| 252 | 0.32 | 276 | 0.023 |
| 253 | 0.65 | 279 | 0.017 |
| 254 | 0.038 | 280 | 0.016 |
| 255 | 0.038 | 281 | 0.052 |
| 256 | 0.079 | 282 | 0.019 |

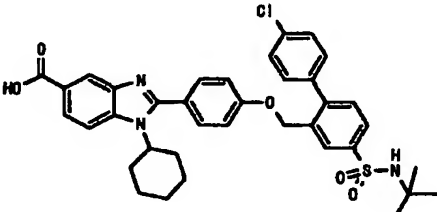
表 1 8 3

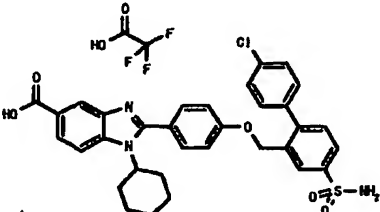
| 実施例 番号 | H C Vポリメラーゼ 阻害活性 I C ₅₀ [μM] | 実施例 番号 | H C Vポリメラーゼ 阻害活性 I C ₅₀ [μM] |
|-----------|--------------------------------------------|-----------|--------------------------------------------|
| 283 | 0.014 | 298 | 0.011 |
| 284 | 0.014 | 299 | 0.018 |
| 285 | 0.012 | 300 | 0.045 |
| 286 | 0.014 | 301 | 0.017 |
| 287 | 0.012 | 303 | 0.10 |
| 288 | 0.013 | 304 | 0.017 |
| 289 | <0.01 | 305 | 0.01 |
| 290 | 0.012 | 306 | 0.013 |
| 291 | 0.016 | 307 | 0.022 |
| 292 | 0.015 | 308 | 0.023 |
| 293 | 0.034 | 311 | 0.16 |
| 294 | 0.032 | 312 | 0.023 |
| 295 | 0.045 | 313 | 0.025 |
| 296 | 0.034 | 314 | 0.097 |
| 297 | 0.022 | 315 | 0.028 |

表 1 8 4

| 実施例 番号 | H C Vポリメラーゼ 阻害活性 I C ₅₀ [μM] | 実施例 番号 | H C Vポリメラーゼ 阻害活性 I C ₅₀ [μM] |
|-----------|--------------------------------------------|-----------|--------------------------------------------|
| 316 | 0.022 | 502 | 0.024 |
| 317 | 0.032 | 503 | 0.196 |
| 318 | 0.012 | 601 | 0.32 |
| 319 | 0.030 | 701 | 0.052 |

表 185

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 249 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.02 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=1.8Hz), 7.96-7.81 (3H, m), 7.67 (1H, s), 7.61-7.49 (6H, m), 7.08 (2H, d, J=8.6Hz), 5.19 (2H, s), 4.25 (1H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.56 (1H, m), 1.46-1.16 (3H, m), 1.11 (9H, s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 672 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 250 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, d, J=1.5Hz), 8.16-8.08 (2H, m), 7.99-7.88 (2H, m), 7.66 (2H, d, J=8.6Hz), 7.60-7.48 (5H, m), 7.19 (2H, d, J=8.6Hz), 5.17 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39-2.20 (2H, m), 2.04-1.79 (4H, m), 1.72-1.60 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 616 (M+1) | |

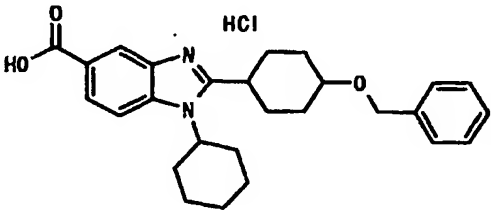
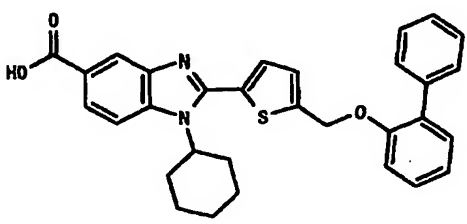
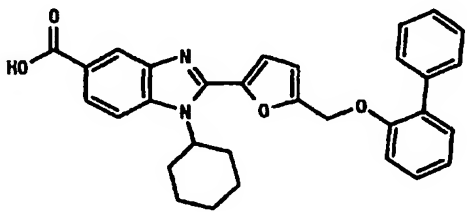
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 251 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 cis and trans mixture 8.13 and 8.11 (total 1H, each s), 7.90-7.74 (2H, m), 7.42-7.22 (5H, m), 4.56 and 4.52 (total 2H, each s), 4.42 (1H, brs), 3.78-3.06 (2H, m), 2.33-1.33 (18H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 433 (M+1) | |

表 186

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 252 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.20 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.84 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.54 (2H, d, J=6.9Hz), 7.48-7.26 (8H, m), 7.09 (1H, t, J=7.3Hz), 5.43 (2H, s), 4.06 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.01-1.80 (4H, m), 1.75-1.64 (1H, m), 1.51-1.28 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 509 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 253 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.54-7.47 (2H, m), 7.40-7.24 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=3.6Hz), 7.11-7.05 (1H, m), 6.81 (1H, d, J=3.6Hz), 5.26 (2H, s), 4.96 (1H, m), 2.32-2.13 (2H, m), 1.95-1.72 (4H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.43-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 493 (M+1) | |

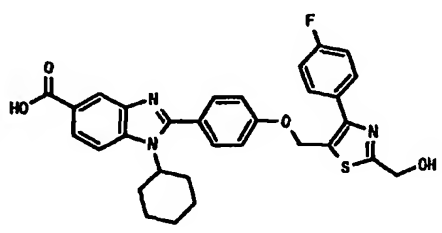
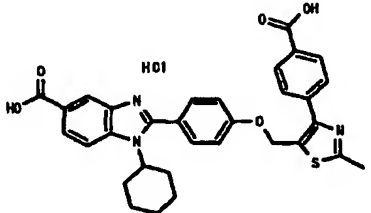
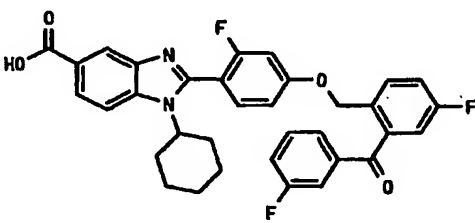
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 254 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90 (1H, dd, J=8.4, 1.4Hz), 7.80-7.71 (2H, m), 7.67 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33 (2H, t, J=8.7Hz), 7.26 (2H, d, J=8.7Hz), 5.46 (2H, s), 4.78 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39-2.19 (2H, m), 2.03-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.17 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 558 (M+1) | |

表 187

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 255 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.34 (1H, s), 8.32 (1H, d, J=8.8Hz), 8.09-8.03 (3H, m), 7.83 (2H, d, J=8.3Hz), 7.79 (2H, d, J=8.8Hz), 7.36 (2H, d, J=8.8Hz), 5.54 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.74 (3H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.13-1.96 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.73-1.57 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 568 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 256 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.67 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.79 (1H, dd, J=8.7, 5.4Hz), 7.62-7.41 (7H, m), 6.80 (1H, dd, J=11.9, 2.3Hz), 6.69 (1H, dd, J=8.1, 2.1Hz), 5.20 (2H, s), 3.93 (1H, brt, J=15.3Hz), 2.30-2.11 (2H, brm), 1.88-1.74 (4H, brm), 1.64-1.58 (1H, brm), 1.41-1.14 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 585 (M+1) | |

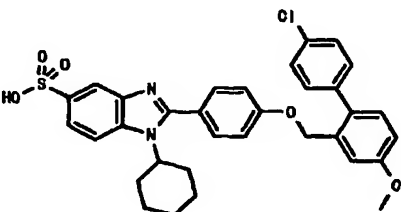
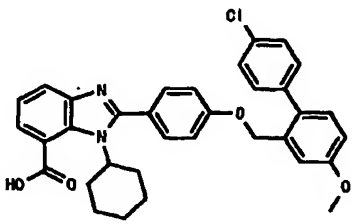
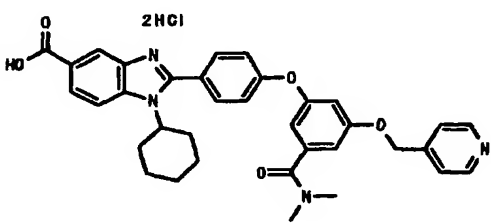
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 257 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.19 (1H, d, J=8.7Hz), 7.93 (1H, s), 7.83-7.71 (3H, m), 7.50-7.39 (4H, m), 7.34-7.10 (4H, m), 7.06 (1H, dd, J=8.4, 2.9Hz), 5.09 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.82 (3H, s), 2.39-2.19 (2H, m), 2.11-1.98 (2H, m), 1.94-1.79 (2H, m), 1.74-1.58 (1H, m), 1.52-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 603 (M+1) | |

表 188

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 258 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 7.79 (1H, d, J=6.7Hz), 7.56 (1H, d, J=7.5Hz), 7.49 (2H, d, J=8.6Hz), 7.42 (4H, s), 7.32-7.23 (3H, m), 7.09-7.03 (3H, m), 5.02 (2H, s), 4.46 (1H, m), 3.82 (3H, s), 1.95-1.83 (2H, m), 1.75-1.44 (5H, m), 1.30-1.10 (2H, m), 0.89-0.71 (1H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 567 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 259 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.6Hz), 8.36 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.7Hz), 8.10-8.03 (3H, m), 7.85 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (1H, s), 7.23 (1H, s), 6.81 (1H, s), 5.56 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.97, 2.92 (6H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.16-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 591 (M+1) | |

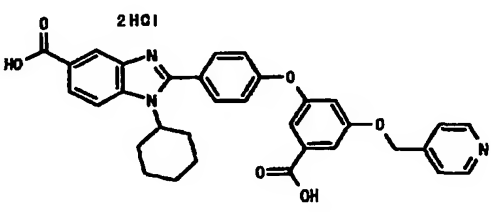
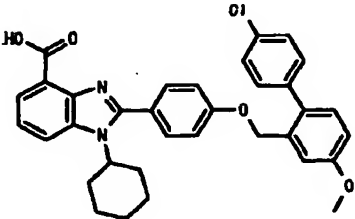
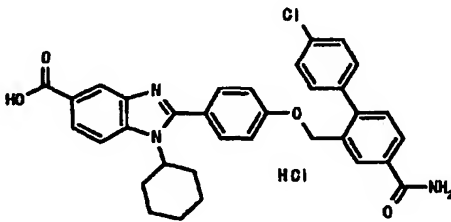
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 260 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.3Hz), 8.35 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.09-8.02 (3H, m), 7.86 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50 (1H, s), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=7.8Hz), 5.60 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.50-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 564 (M+1) | |

表 189

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 261 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, d, J=7.8Hz), 7.85 (1H, d, J=6.7Hz), 7.63 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51-7.38 (5H, m), 7.29 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (1H, d, J=3.0Hz), 7.06 (2H, d, J=9.0Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.6, 3.0Hz), 5.05 (2H, s), 4.41-4.25 (1H, m), 3.83 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 567 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 262 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.26 (1H, d, J=9.0Hz), 8.19 (1H, d, J=1.8Hz), 8.13 (1H, brs), 8.08-7.96 (2H, m), 7.73 (2H, d, J=9.0Hz), 7.57-7.43 (6H, m), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.38-2.18 (2H, m), 2.12-1.97 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.73-1.58 (1H, m), 1.52-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 580 (M+1) | |

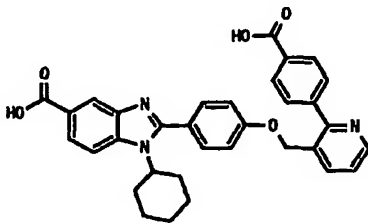
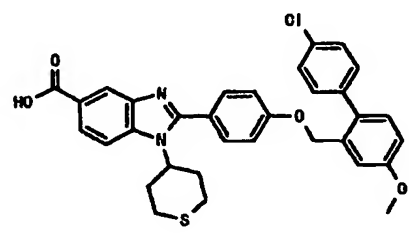
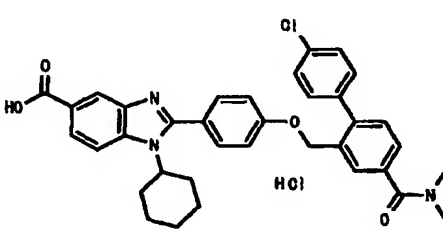
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 263 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, brs), 8.72 (1H, d, J=4.8Hz), 8.22 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=6.3Hz), 8.03 and 7.76 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.93a and 7.85 (2H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.60 and 7.15 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.55 (1H, dd, J=6.3, 4.8Hz), 5.19 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=12.6Hz), 2.35-2.18 (2H, brm), 1.95-1.77 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.45-1.15 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 548 (M+1) | |

表 190

| 実施例番号 | 264 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, d, J=1.0Hz), 7.92 (1H, dd, J=8.7, 1.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.60 (2H, d, J=8.6Hz), 7.47 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44 (2H, d, J=8.7Hz), 7.30 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (1H, d, J=2.6Hz), 7.11 (2H, d, J=8.7Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.7, 2.6Hz), 5.04 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.83 (3H, s), 2.80-2.70 (4H, m), 2.60-2.40 (2H, m), 2.30-2.20 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 586, 588 (M+1) | |

| 実施例番号 | 265 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.25 (1H, d, J=9.1Hz), 8.03 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.76-7.96 (3H, m), 7.55-7.49 (5H, m), 7.42 (1H, d, J=7.6Hz), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.37-2.20 (2H, m), 2.09-1.97 (2H, m), 1.94-1.81 (2H, m), 1.72-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 608 (M+1) | |

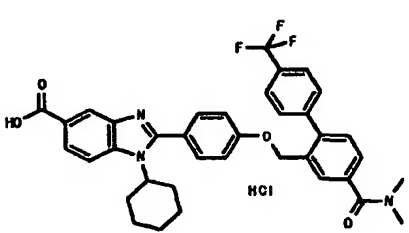
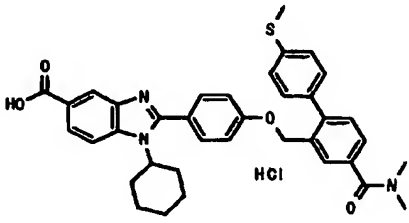
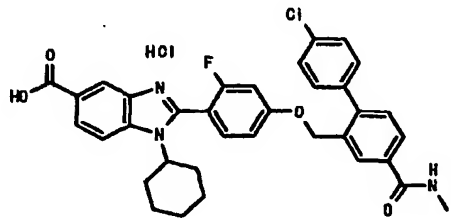
| 実施例番号 | 266 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, d, J=1.5Hz), 8.20 (1H, d, J=9.0Hz), 8.00 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.82 (2H, d, J=8.2Hz), 7.76-7.65 (5H, m), 7.56 (1H, dd, J=7.9, 1.8Hz), 7.47 (1H, d, J=7.5Hz), 7.20 (2H, d, J=8.6Hz), 5.16 (2H, s), 4.32 (1H, m), 3.02 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.38-2.19 (2H, m), 2.07-1.95 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.52-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 642 (M+1) | |

表 191

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 267 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.34 (2H, m), 8.03 (1H, d, J=8.3Hz), 7.77-7.68 (3H, m), 7.54-7.40 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.6Hz), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.16 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.11-1.97 (2H, m), 1.93-1.81 (2H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 620 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 268 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.67-8.59 (1H, m), 8.30 (1H, s), 8.13-8.20 (2H, m), 8.02-7.92 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.3Hz), 7.56-7.45 (5H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.09 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.5Hz), 2.34-2.12 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.49-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 612 (M+1) | |

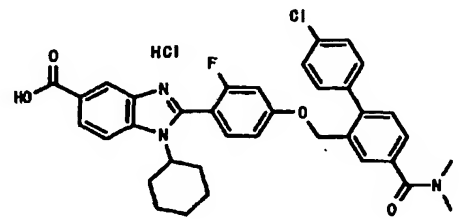
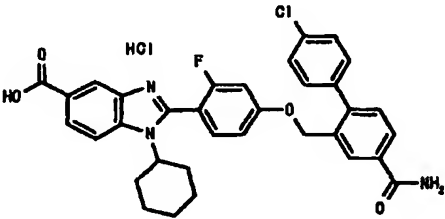
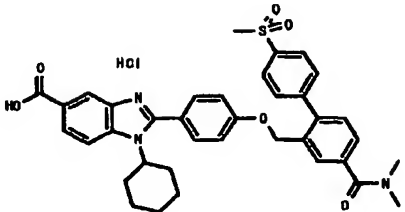
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 269 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=9.0Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.71 (1H, d, J=1.8Hz), 7.63 (1H, t, J=8.2Hz), 7.56-7.41 (6H, m), 7.17 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.2, 1.8Hz), 5.14 (2H, s), 4.15-4.00 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.32-2.13 (2H, m), 1.95-1.79 (4H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.45-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 626 (M+1) | |

表 192

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 270 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=1.4Hz), 8.19 (1H, d, J=1.8Hz), 8.11 (1H, br s), 8.02-7.85 (3H, m), 7.60-7.44 (7H, m), 7.10 (1H, dd, J=12.0, 2.1Hz), 6.98 (1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 5.11 (2H, s), 3.98 (1H, m), 2.30-2.12 (2H, m), 1.91-1.73 (4H, m), 1.71-1.58 (1H, m), 1.45-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 598 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 271 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.24 (1H, d, J=8.7Hz), 8.07-7.98 (3H, m), 7.80-7.68 (5H, m), 7.56 (1H, dd, J=8.0, 1.8Hz), 7.47 (1H, d, J=8.0Hz), 7.21 (2H, d, J=8.4Hz), 5.18 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.27 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.38-2.18 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.93-1.79 (2H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.50-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 652 (M+1) | |

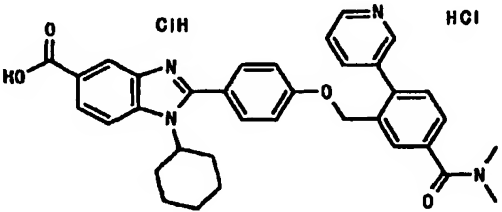
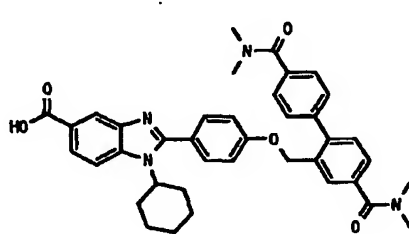
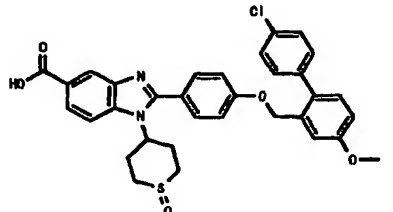
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 272 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.97 (1H, d, J=1.8Hz), 8.85 (1H, d, J=4.7Hz), 8.46 (1H, d, J=8.0Hz), 8.39-8.26 (2H, m), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99-7.64 (6H, m), 7.24 (2H, d, J=8.7Hz), 5.25 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.03 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.39-2.19 (2H, m), 2.14-1.96 (2H, m), 1.94-1.78 (2H, m), 1.73-1.60 (1H, m), 1.21-1.55 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 575 (M+1) | |

表 193

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 273 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77-7.67 (3H, m), 7.58-7.48 (6H, m), 7.22 (2H, d, J=8.4Hz), 5.18 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=9.8Hz), 3.06-2.88 (12H, brm), 2.38-2.20 (2H, brm), 2.08-1.96 (2H, brm), 1.90-1.80 (2H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.49-1.22 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 645 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 274 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 mixture of cis and trans 8.35, 8.34 (1H, s), 8.15-8.10 (2H, m), 7.79-7.70 (3H, m), 7.49 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44 (2H, d, J=8.7Hz), 7.31 (1H, d, J=8.4Hz), 7.25-7.19 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=8.5Hz), 5.08 (2H, s), 4.75 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.70-1.90 (8H, m) |
| 純度 | 約80% (NMR) | |
| MS | 601 (M+1) | |

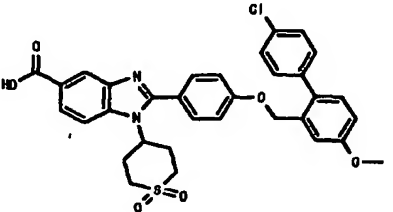
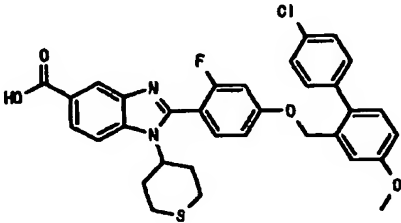
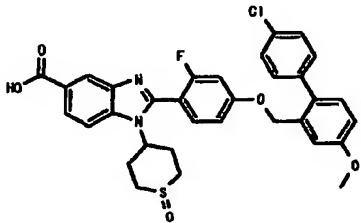
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 275 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=7.5Hz), 7.93 (1H, d, J=8.8Hz), 7.74 (2H, d, J=8.7Hz), 7.49 (2H, d, J=8.6Hz), 7.44 (2H, d, J=8.6Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.25-7.15 (3H, m), 7.07 (1H, d, J=8.5Hz), 5.08 (2H, s), 4.98 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.65-3.45 (2H, m), 3.30-3.10 (2H, m), 3.00-2.75 (2H, m), 2.60-2.30 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 617 (M+1) | |

表 194

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 276 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.25 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=9.1Hz), 7.55 (1H, t, J=8.6Hz), 7.48 and 7.42 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.24 (1H, d, J=2.6Hz), 7.09-6.95 (3H, m), 5.05 (2H, s), 4.11 (1H, brt, J=14.0Hz), 3.84 (3H, s), 2.83-2.67 (4H, brm), 2.50-2.32 (2H, brm), 2.21-2.10 (2H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 603 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 277 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ cis and trans mixture 8.28 and 8.24 (total 1H, each s), 7.94-7.87 (1H, m), 7.60-7.41 (5H, m), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.23-7.21 (1H, m), 7.12-7.05 (2H, m), 7.00-6.95 (1H, m), 5.06 and 5.05 (total 2H, each s), 4.47 and 4.34 (total 1H, each brs), 3.83 (3H, s), 3.12-1.76 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 619 (M+1) | |

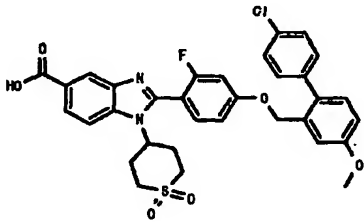
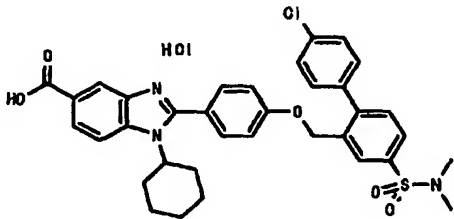
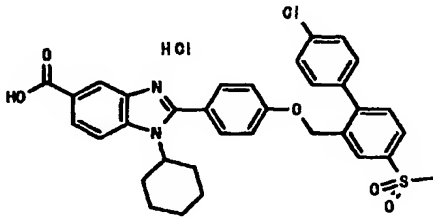
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 278 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 12.9 (1H, brs), 8.27 (1H, s), 7.97 and 7.74 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.58 (1H, t, J=8.6Hz), 7.49 and 7.43 (4H, A'B'q, J=8.5Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.22 (1H, d, J=2.6Hz), 7.13-6.92 (3H, m), 5.05 (2H, s), 4.67 (1H, brt, J=14.2Hz), 3.57-3.40 (2H, brm), 3.20-3.05 (2H, brm), 2.91-2.70 (2H, brm), 2.28-2.11 (2H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 635 (M+1) | |

表 195

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 279 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06-8.00 (2H, m), 7.83 (1H, dd, J=8.0, 1.8Hz), 7.71 (2H, d, J=8.4Hz), 7.64 (1H, d, J=8.0Hz), 7.59-7.54 (4H, m), 7.22 (2H, d, J=8.4Hz), 5.25 (2H, s), 4.33 (1H, m), 2.66 (3H, s), 2.66 (3H, s), 2.37-2.19 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.47-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 644 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 280 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.32-8.23 (3H, m), 8.08-8.01 (2H, m), 7.73 (2H, d, J=8.6Hz), 7.65 (1H, d, J=8.2Hz), 7.59-7.51 (4H, m), 7.25 (2H, d, J=8.6Hz), 5.21 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.32 (3H, s), 2.37-2.19 (2H, m), 2.10-1.98 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.51-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 615 (M+1) | |

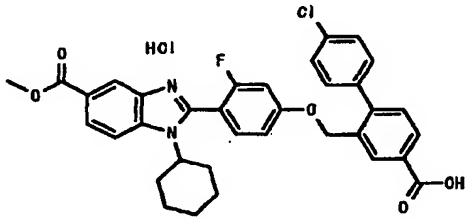
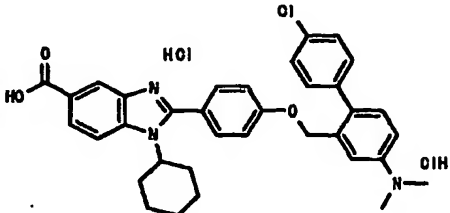
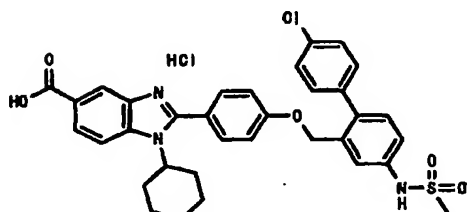
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 281 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.24 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.6Hz), 8.07-7.95 (2H, m), 7.63 (1H, t, J=8.6Hz), 7.57-7.47 (5H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.17 (2H, s), 4.06 (1H, m), 3.90 (3H, s), 2.31-2.11 (2H, m), 1.97-1.78 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.43-1.22 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 315 | |

表 196

| 実施例番号 | 282 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, s), 8.35 (1H, d, J=9.3Hz), 8.09 (1H, d, J=9.3Hz), 7.78 (2H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.25 (9H, m), 5.09 (2H, s), 4.39 (1H, m), 3.04 (6H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 580 (M+1) | |

| 実施例番号 | 283 | 1H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 10.03 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06 (1H, d, J=9.0Hz), 7.74 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51-7.42 (5H, m), 7.37-7.30 (2H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.10 (2H, s), 4.37 (1H, m), 3.06 (3H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 630 (M+1) | |

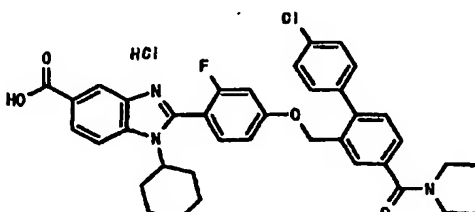
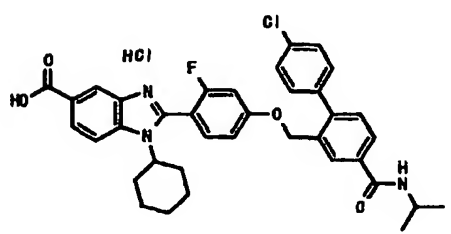
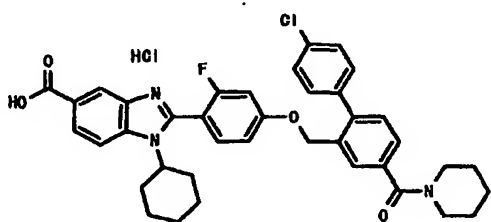
| 実施例番号 | 284 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96-7.41 (8H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.15 (2H, s), 4.15 (1H, m), 3.54-3.16 (4H, m), 2.33-2.13 (2H, m), 1.97-1.79 (4H, m), 1.70-1.02 (9H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 654 (M+1) | |

表 197

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 285 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.37 (1H, d, J=7.3Hz), 8.30 (1H, s), 8.19-8.12 (2H, m), 8.02-7.95 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.4Hz), 7.56-7.43 (5H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.0, 1.8Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 5.13 (2H, s), 4.22-4.03 (2H, m), 2.34-2.13 (2H, m), 1.99-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.44-1.14 (3H, m), 1.20, 1.18 (6H, each s) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 640 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 286 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.69-7.40 (8H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.15 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.71-3.23 (2H, m), 1.98-1.71 (4H, m), 1.71-1.18 (10H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 666 (M+1) | |

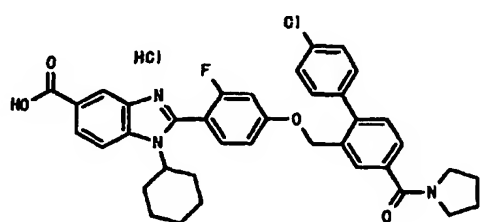
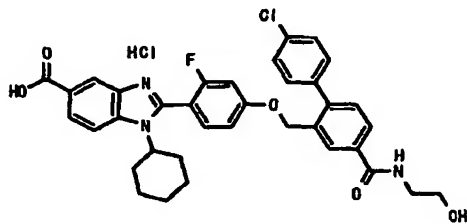
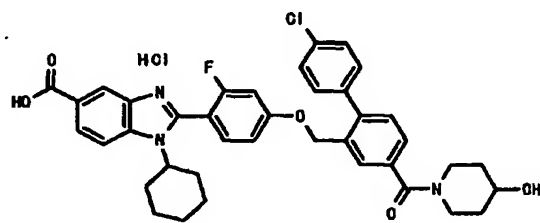
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 287 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.0Hz), 7.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.83 (1H, s), 7.68-7.41 (7H, m), 7.17 (1H, d, J=12.0Hz), 7.03 (1H, d, J=8.4Hz), 5.15 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.58-3.41 (4H, m), 2.34-2.13 (2H, m), 1.97-1.77 (8H, m), 1.71-1.58 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 652 (M+1) | |

表 198

| 実施例番号 | 288 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.62 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.22-8.14 (2H, m), 8.99 (2H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, t, J=7.7Hz), 7.58-7.44 (5H, m), 7.19 (1H, dd, J=8.7, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.67-3.49 (2H, m), 3.45-3.30 (2H, m), 2.37-2.12 (2H, m), 2.00-1.76 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.17 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 642 (M+1) | |

| 実施例番号 | 289 | 1H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 400MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.9Hz), 7.96 (1H, d, J=8.9Hz), 7.68 (1H, s), 7.62 (1H, t, J=8.2Hz), 7.55-7.41 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=11.7Hz), 7.02 (1H, d, J=8.4Hz), 5.14 (2H, s), 4.12-3.13 (6H, m), 2.30-1.19 (13H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 682 (M+1) | |

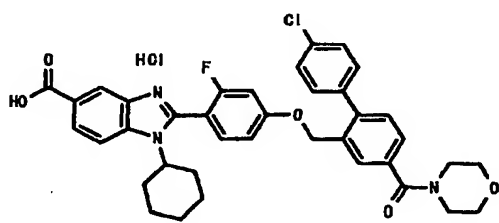
| 実施例番号 | 290 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 400MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=8.6Hz), 7.98 (1H, d, J=8.8Hz), 7.72 (1H, s), 7.64 (1H, t, J=8.8Hz), 7.57-7.43 (6H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.1Hz), 7.03 (1H, d, J=10.7Hz), 5.12 (2H, s), 4.15-4.01 (1H, m), 3.75-3.33 (8H, m), 2.31-2.14 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.47-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 668 (M+1) | |

表 199

| | | |
|-------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 291 | ¹ H NMR (δ) ppm 400MHz, DMSO-d ₆ 8. 29 (1H, s), 8. 14 (1H, d, J=8 . 9Hz), 7. 97 (1H, d, J=8. 6Hz) , 7. 71 (1H, s), 7. 63 (1H, t, J= 8. 2Hz), 7. 56-7. 42 (6H, m), 7 . 17 (1H, d, J=12. 3Hz), 7. 03 (1H, d, J=10. 7Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 07 (1H, m), 3. 96-3. 52 (4 H, m), 2. 79-2. 56 (4H, m), 2. 3 2-2. 14 (2H, m), 1. 97-1. 79 (4 H, m), 1. 71-1. 58 (1H, m), 1. 5 1-1. 19 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 684 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 292 | ¹ H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ 9. 07-8. 99 (1H, m), 8. 30 (1H, s), 8. 23-8. 12 (2H, m), 8. 04-7. 95 (2H, m), 7. 65 (1H, t, J=8. 2Hz), 7. 60-7. 45 (5H, m), 7. 19 (1H, dd, J=12. 0, 2. 6Hz), 7. 06 (1H, dd, J=8. 6, 2. 2Hz), 5. 16 (2H, s), 4. 18-4. 02 (1H, m), 3. 97 (2H, d, J=6. 0Hz), 2. 33-2. 14 (2H, m), 1. 99-1. 79 (4H, m), 1. 72-1. 59 (1H, m), 1. 45-1. 19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 656 (M+1) | |

| | | |
|-------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 293 | ¹ H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d ₆ : 8. 21 (1H, s), 7. 94and7. 86 (2H, ABq, J=8. 6Hz), 7. 72 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 59and7. 11 (4H, A' B' q, J=8. 9Hz), 7. 53 (1H, dd, J=8. 4, 2. 4Hz), 7. 38 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 36and7. 32 (4H, A" B" q, J=8. 1Hz), 5. 07 (2H, s), 4. 27 (1H, brt, J=13. 8Hz), 2. 87 (2H, t, J=7. 8Hz), 2. 57 (2H, t, J=7. 8Hz), 2. 35-2. 20 (2H, brm), 1. 96-1. 79 (4H, brm), 1. 68-1. 59 (1H, brm), 1. 47-1. 18 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 637 (M+1) | |

表 200

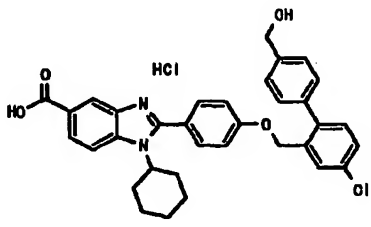
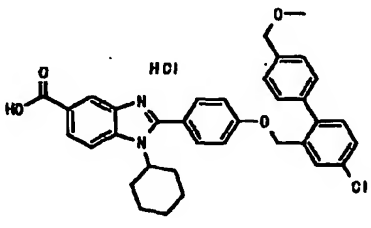
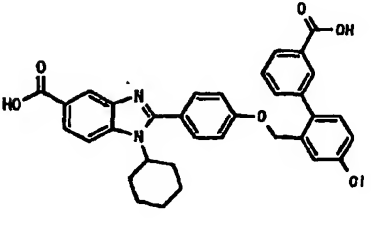
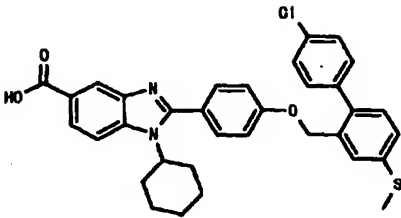
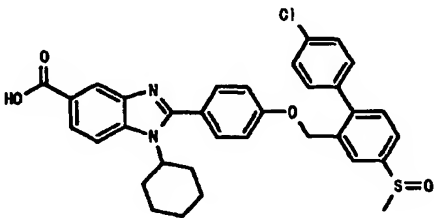
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 294 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.30 (1H, s), 8.25 and 8.03 (2H, ABq, J=8.9Hz), 7.73 (1H, s), 7.73 (2H, d, J=8.6Hz), 7.55 (1H, dd, J=8.0, 2.3Hz), 7.40 (4H, s), 7.39 (1H, d, J=8.0Hz), 7.23 (2H, d, J=8.6Hz), 5.11 (2H, s), 4.55 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=14.8Hz), 2.37-2.19 (2H, brm), 2.09-1.96 (2H, brm), 1.91-1.79 (2H, brm), 1.71-1.59 (1H, brm), 1.50-1.20 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 567 (M+1) | |
| 実施例番号 | 295 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.30 (1H, s), 8.25 and 8.04 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.74 (1H, s), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56 (1H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.35 (5H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.46 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=14.8Hz), 3.31 (3H, s), 2.37-2.17 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.92-1.79 (2H, brm), 1.73-1.56 (1H, brm), 1.52-1.20 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 581 (M+1) | |
| 実施例番号 | 296 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, d, J=1.2Hz), 7.97-7.91 (2H, m), 7.84 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.77 (1H, d, J=2.1Hz), 7.70 (1H, d, J=7.5Hz), 7.60-7.54 (4H, m), 7.43 (1H, d, J=8.4Hz), 7.09 (2H, d, J=8.7Hz), 5.05 (2H, s), 4.25 (1H, brt, J=14.8Hz), 2.36-2.18 (2H, brm), 1.95-1.79 (4H, brm), 1.71-1.61 (1H, brm), 1.43-1.18 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 581 (M+1) | |

表 201

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 297 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.60-7.55 (3H, m), 7.49 and 7.45 (4H, A' B' q, J=8.3Hz), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.0 5 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=13 .0Hz), 2.54 (3H, s), 2.38-2. 20 (2H, brm), 1.97-1.80 (4H, brm), 1.71-1.59 (1H, brm), 1 .47-1.20 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 583 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 298 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7. 95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.79 (1H, d, J=7.8Hz), 7.5 8 (3H, t, J=7.5Hz), 7.53 (4H, s), 7.13 (2H, d, 8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=13. 8Hz), 2.83 (3H, s), 2.37-2.1 8 (2H, brm), 1.95-1.78 (4H, b rm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1. 47-1.17 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 599 (M+1) | |

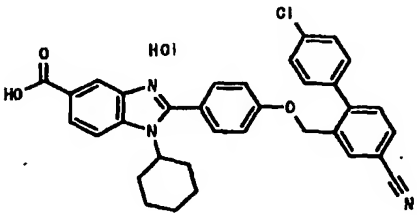
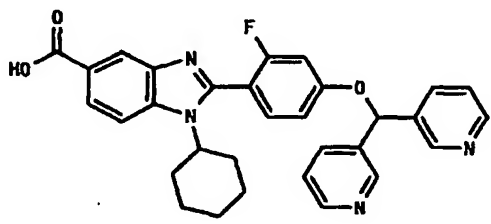
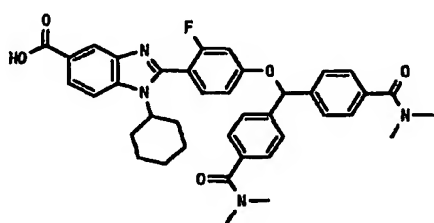
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 299 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.43-8.16 (3H, m), 8.07-7.9 4 (2H, m), 7.72 (2H, d, J=8.6H z), 7.62-7.49 (5H, m), 7.23 (2H, d, J=8.6Hz), 5.16 (2H, s) , 4.34 (1H, m), 2.39-2.20 (2H , m), 2.10-1.96 (2H, m), 1.93 -1.80 (2H, m), 1.71-1.58 (1H , m), 1.49-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 562 (M+1) | |

表 202

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 300 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ : 2.77 (1H, brs), 8.83 (2H, d, J=1.9Hz), 8.56 (2H, dd, J=4.9, 1.9Hz), 8.22 (1H, d, J=1.5Hz), 7.97 (2H, dt, J=7.9, 1.9Hz), 7.95 (1H, d, J=8.6Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.57 (1H, t, J=8.7Hz), 7.46 (2H, dd, J=7.9, 4.9Hz), 7.26 (1H, dd, J=12.0, 4.9Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.8, 2.3Hz), 6.99 (2H, s), 3.94 (1H, brt), 2.26-2.09 (2H, m), 1.87-1.73 (4H, m), 1.67-1.57 (1H, m), 1.42-1.12 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 523 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 301 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.22 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=1.5Hz, 9.0Hz), 7.62 (4H, d, J=8.4Hz), 7.55 (1H, t, J=9.0Hz), 7.44 (4H, d, J=8.1Hz), 7.20 (1H, dd, J=2.1Hz, 12.0Hz), 7.11 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.7Hz), 6.86 (1H, s), 3.94 (1H, m), 2.96, 2.88 (12H, s), 2.35-2.00 (2H, m), 1.95-1.70 (4H, m), 1.65-1.50 (1H, m), 1.45-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 663 (M+1) | |

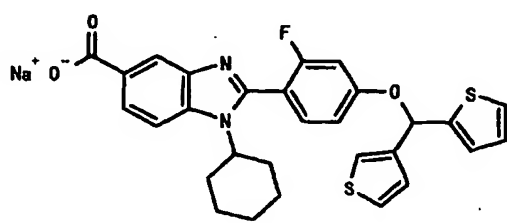
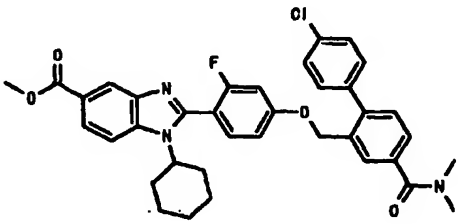
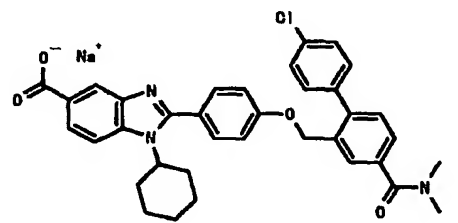
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 302 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.14 (1H, s), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.68 (1H, d, J=8.7Hz), 7.64-7.55 (3H, m), 7.50 (1H, t, J=8.7Hz), 7.22-7.17 (3H, m), 7.11 (1H, s), 7.08-7.00 (2H, m), 3.90 (1H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.95-1.50 (5H, m), 1.45-1.00 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 532 (M+1) | |

表 203

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 303 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDC13 8.49 (1H, s), 7.98 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.71 (1H, d, J=1.8Hz), 7.66 (1H, d, J=8.6Hz), 7.55-7.29 (7H, m), 6.80 (1H, dd, J=8.2, 2.2Hz), 6.69 (1H, dd, J=11.2, 2.2Hz), 4.99 (2H, s), 4.10-3.92 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.15 (3H, s), 3.06 (3H, s), 2.31-2.14 (2H, m), 2.04-1.86 (4H, m), 1.81-1.71 (1H, m), 1.41-1.21 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 640 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 304 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.84 (1H, d, J=9.1Hz), 7.70 (1H, s), 7.26-7.39 (9H, m), 7.11 (2H, d, J=8.4Hz), 5.11 (2H, s), 4.26 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.38-2.19 (2H, m), 1.97-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.48-1.17 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 608 (M+1) | |

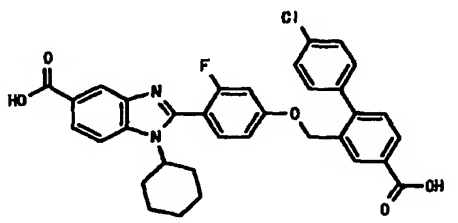
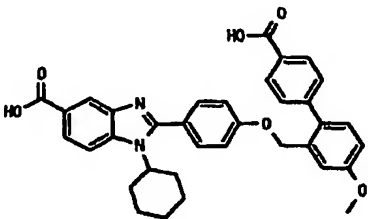
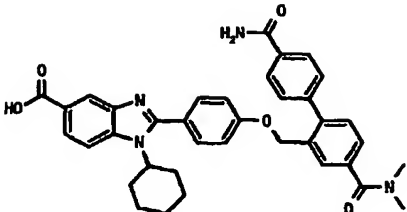
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 305 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.24 (2H, s), 8.03 (1H, d, J=8.0Hz), 7.96 (1H, d, J=8.8Hz), 7.87 (1H, d, J=9.1Hz), 7.60-7.46 (6H, m), 7.09 (1H, dd, J=12.0, 1.8Hz), 6.97 (1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 5.16 (2H, s), 3.97 (1H, m), 2.31-2.11 (2H, m), 1.92-1.73 (4H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.46-1.13 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 599 (M+1) | |

表 204

| 実施例番号 | 306 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| |  | 300MHz, DMSO-d6 12.84 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 7.98-7.84 (5H, m), 7.58 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54 (2H, d, J= 7.8Hz), 7.34 (1H, d, J=8.7H z), 7.26 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 13-7.06 (3H, m), 5.06 (2H, s) , 4.26 (1H, brt, J=12.7Hz), 3 .84 (3H, s), 2.36-2.17 (2H, b rm), 1.99-1.80 (4H, brm), 1. 73-1.59 (1H, brm), 1.47-1.1 7 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 577 (M+1) | |

| 実施例番号 | 307 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------|------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| |  | 300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7. 96 (2H, d, J=8.1Hz), 7.87 (2H , s), 7.72 (1H, d, J=1.2Hz), 7 .59-7.41 (7H, m), 5.12 (2H, s), 4.25 (1H, brt, J=11.8Hz), 3.02 (3H, brs), 2.98 (3H, brs), 2.38-2.15 (2H, brm), 1.93 -1.76 (4H, brm), 1.71-1.59 (1H, brm), 1.46-1.16 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 617 (M+1) | |

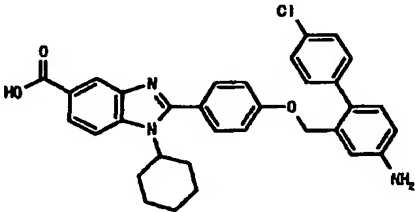
| 実施例番号 | 308 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| |  | 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=9 .0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz) , 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.46 (2H, d, J=8.1Hz), 7.42 (2H, d , J=8.4Hz), 7.30-7.04 (5H, m), 5.03 (2H, s), 4.32 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.05-1.1 0 (8H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 552 (M+1) | |

表 205

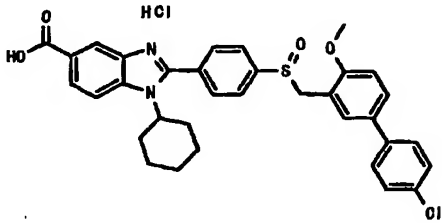
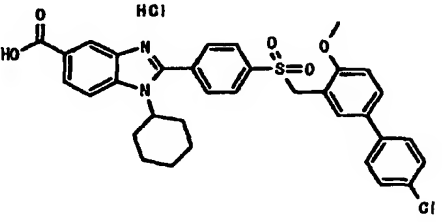
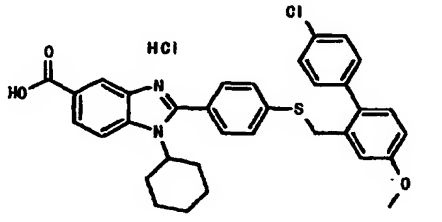
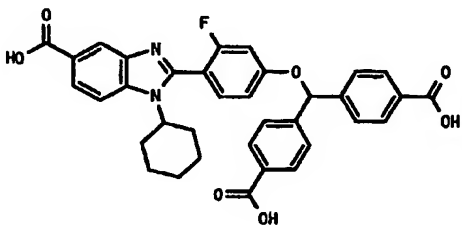
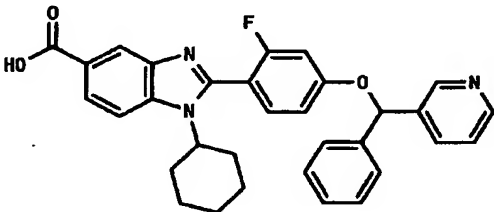
| 実施例番号 | 309 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.15 and 7.99 (2H, ABq, J=8.9Hz), 7.84 and 7.59 (4H, A'B'q, J=8.3Hz), 7.46 (2H, d, J=8.4Hz), 7.22-7.16 (3H, m), 7.01-6.98 (2H, m), 4.27 and 4.23 (2H, A''B''q, J=12.9Hz), 3.78 (3H, s), 2.39-2.21 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.91-1.80 (2H, brm), 1.72-1.59 (1H, brm), 1.49-1.17 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | | |
| 実施例番号 | 310 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.09 and 7.95 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.87 and 7.71 (4H, A'B'q, J=8.0Hz), 7.43 (2H, d, J=7.8Hz), 7.15 (1H, d, J=8.7Hz), 7.07-7.02 (4H, m), 4.66 (2H, s), 4.23 (1H, brt, J=11.8Hz), 3.76 (3H, s), 2.38-2.20 (2H, brm), 2.04-1.93 (2H, brm), 1.89-1.79 (2H, brm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1.49-1.18 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 615 (M+1) | |
| 実施例番号 | 311 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.21 and 8.01 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.41 (6H, m), 7.20 (1H, d, J=8.4Hz), 7.14 (1H, d, J=2.7Hz), 6.97 (1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 4.31 (1H, brt, J=9.8Hz), 4.28 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.37-2.20 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.92-1.80 (2H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.50-1.19 (3H, brm) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 583 (M+1) | |

表 206

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 312 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.22 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.4Hz), 8.00-7.84 (5H, m), 7.70 (4H, d, J=8.4Hz), 7.56 (1H, t, J=8.6Hz), 7.23 (1H, d, J=12.0Hz), 7.13 (1H, d, J=8.6Hz), 6.97 (1H, s), 3.92 (1H, m), 2.35-2.00 (2H, m), 1.95-1.70 (4H, m), 1.65-1.55 (1H, m), 1.50-1.05 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 609 (M+1) | |

| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 313 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.89 (1H, brs), 8.63 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=7.8Hz), 7.99 (1H, d, J=8.8Hz), 7.89 (1H, d, J=9.9Hz), 7.61-7.55 (4H, m), 7.43 (2H, t, J=7.7Hz), 7.34 (1H, t, J=7.2Hz), 7.24 (1H, d, J=12.0Hz), 7.14 (1H, d, J=8.6Hz), 6.95 (1H, s), 3.96 (1H, m), 2.35-2.05 (2H, m), 2.00-1.50 (5H, m), 1.45-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 522 (M+1) | |

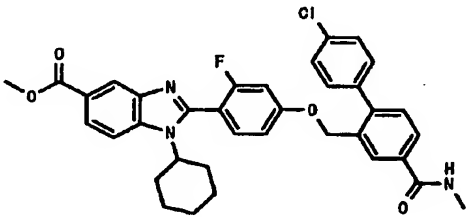
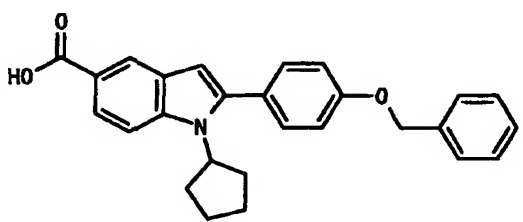
| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 314 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, CDCl ₃ 8.48 (1H, d, J=1.4Hz), 8.05 (1H, d, J=1.8Hz), 8.98 (1H, d, J=8.6Hz), 7.82 (1H, d, J=7.9Hz), 7.66 (1H, d, J=8.6Hz), 7.55-7.24 (6H, m), 6.78 (1H, d, J=8.6, 2.6Hz), 6.69 (1H, d, J=11.6Hz), 2.2Hz), 6.40-6.30 (1H, m), 4.99 (2H, s), 4.02 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.05 (3H, d, J=4.8Hz), 2.32-2.13 (2H, m), 2.03-1.87 (4H, m), 1.81-1.71 (1H, m), 1.46-1.23 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 626 (M+1) | |

表 207

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 503 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.76 (1H, d, J=8.7Hz), 7.58 (1H, d, J=8.8Hz), 7.51-7.32 (7H, m), 7.17 (2H, d, J=8.7Hz), 6.55 (1H, s), 5.18 (2H, s), 4.75 (1H, m), 2.35-2.12 (2H, m), 2.10-1.85 (4H, m), 1.80-1.50 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 412 (M+1) | |

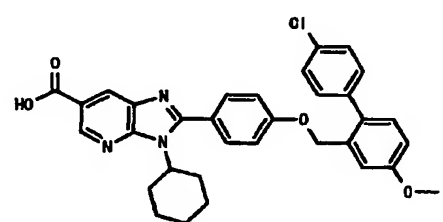
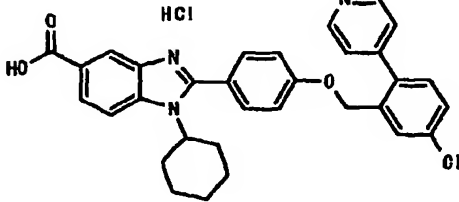
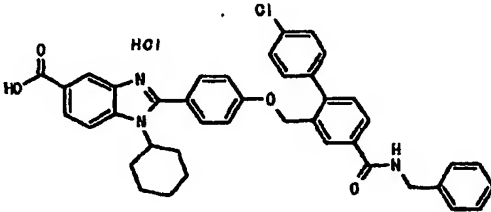
| | | |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 701 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.96 (1H, s), 8.50 (1H, s), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.40 (4H, m), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.24 (1H, d, J=2.4Hz), 7.16 (2H, d, J=8.4Hz), 7.06 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.1Hz), 5.06 (2H, s), 4.31 (1H, s), 3.83 (3H, s), 2.80-2.55 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.40-1.15 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 568 (M+1) | |

表 208

| 実施例番号 | 315 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.84 (2H, d, J=6.3Hz), 8.28 (1H, s), 8.17 and 7.99 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.87-7.85 (3H, m), 7.70-7.50 (3H, m), 7.52 (1H, d, J=8.3Hz), 7.18 (2H, d, J=8.7Hz), 5.22 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.5Hz), 2.36-2.18 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.50-1.23 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 538 (M+1) | |

| 実施例番号 | 316 | 1H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 9.23 (1H, t, J=6.3Hz), 8.29 (1H, s), 8.25-8.22 (2H, m), 8.03 (2H, d, J=7.9Hz), 7.55-7.48 (5H, m), 7.34 (4H, d, J=4.4Hz), 7.28-7.22 (3H, m), 5.15 (2H, s), 4.52 (2H, d, J=5.9Hz), 4.35 (1H, br t, J=12.1Hz), 2.37-2.18 (2H, m), 2.08-1.95 (2H, m), 1.91-1.79 (2H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.47-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 670 (M+1) | |

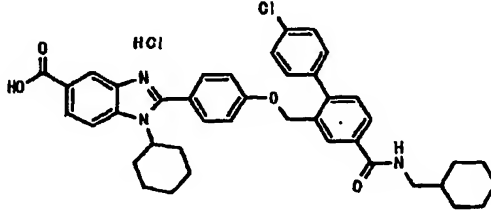
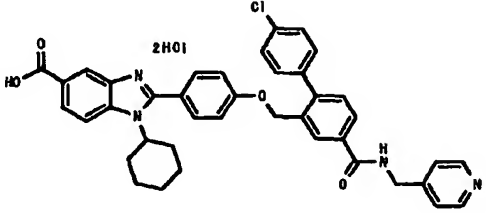
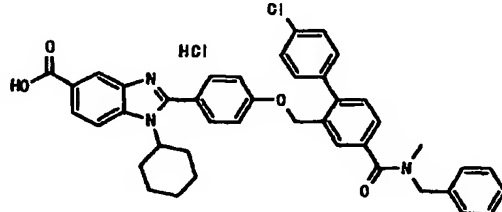
| 実施例番号 | 317 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.59 (1H, t, J=5.5Hz), 8.28 (1H, s), 8.21 and 8.01 (2H, ABq, J=8.8Hz), 8.16 (1H, s), 7.97 and 7.46 (2H, A'B'q, J=8.0Hz), 7.71 and 7.23 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.53 and 7.49 (4H, A'''B'''q, J=9.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.34 (1H, br t, J=12.8Hz), 3.14 (2H, t, J=6.3Hz), 2.38-2.18 (2H, m), 2.07-1.78 (4H, m), 1.78-1.47 (7H, m), 1.47-1.07 (6H, m), 1.03-0.83 (2H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 676 (M+1) | |

表 209

| 実施例番号 | 318 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 9.63 (1H, t, J=4.8Hz), 8.86 and 7.97 (4H, ABq, J=6.6Hz), 8.30 (1H, s), 8.27 (1H, s), 8.23 and 8.03 (2H, A'B'q, J=8.8Hz), 8.09 and 7.54 (2H, A''B''q, J=8.1Hz), 7.73 and 7.24 (4H, A'''B'''q, J=8.8Hz), 7.54 and 7.52 (4H, A''''B''''q, J=8.8Hz), 5.16 (2H, s), 4.78 (2H, d, J=5.6Hz), 4.35 (1H, br t, J=11.0Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 2.07-1.96 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.50-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 671 (M+1) | |

| 実施例番号 | 319 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.28 (1H, s), 8.24 and 8.03 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 (1H, s), 7.70 (2H, d, J=8.4Hz), 7.64-7.10 (13H, m), 5.16 (2H, s), 4.74 and 4.57 (total 2H, each br s), 4.34 (1H, br t, J=11.7Hz), 2.90 (3H, s), 2.35-2.17 (2H, m), 2.07-1.93 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.71-1.57 (1H, m), 1.51-1.19 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 684 (M+1) | |

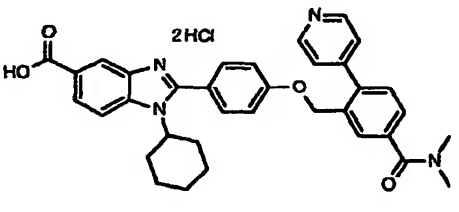
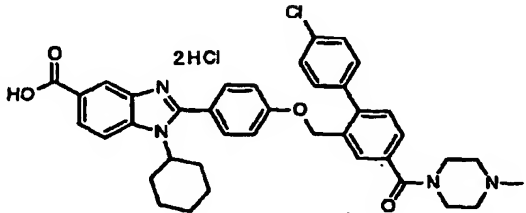
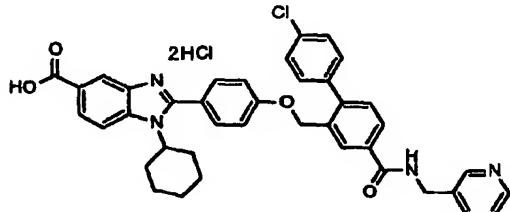
| 実施例番号 | 320 | ¹ H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d ₆ 8.94 and 8.06 (4H, ABq, J=6.8Hz), 8.33 (1H, s), 8.28 and 8.05 (2H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.80 (1H, s), 7.73 and 7.22 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.63 and 7.57 (2H, A'''B'''q, J=7.9Hz), 5.30 (2H, s), 4.34 (1H, br t, J=12.1Hz), 3.04 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.38-2.18 (2H, m), 2.10-1.96 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.52-1.08 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 575 (M+1) | |

表 210

| 実施例番号 | 321 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 11.19 (1H, br s), 8.31 (1H, s), 8.23 and 8.02 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 (1H, s), 7.72 and 7.23 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.59 and 7.48 (2H, A'B''q, J=7.9Hz), 7.53 and 7.51 (4H, A''B''q, J=9.0Hz), 5.16 (2H, s), 4.72-2.97 (8H, br m), 4.34 (1H, br t, J=12.1Hz), 2.79 (3H, s), 2.38-2.17 (2H, m), 2.07-1.93 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 663 (M+1) | |

| 実施例番号 | 322 | 1H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 9.54 (1H, t, J=5.7Hz), 8.91 (1H, s), 8.81 (1H, d, J=4.9Hz), 8.48 (1H, d, J=7.9Hz), 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.25 (1H, s), 8.07-7.97 (3H, m), 7.74 and 7.25 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.56-7.49 (5H, m), 5.16 (2H, s), 4.69 (2H, d, J=5.6Hz), 4.36 (1H, br t, J=12.4Hz), 2.37-2.20 (2H, m), 2.09-1.97 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.50-1.17 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 671 (M+1) | |

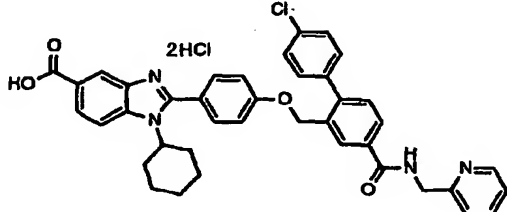
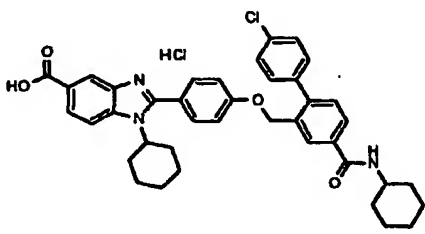
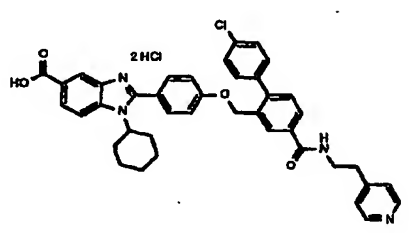
| 実施例番号 | 323 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 9.52 (1H, t, J=6.0Hz), 8.72 (1H, d, J=5.3Hz), 8.30-8.19 (4H, m), 8.08 (1H, d, J=7.9Hz), 8.02 (1H, d, J=7.6Hz), 7.77-7.64 (4H, m), 7.57-7.49 (5H, m), 7.24 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.77 (2H, d, J=5.6Hz), 4.34 (1H, t, J=12.8Hz), 2.36-2.19 (2H, m), 2.07-1.95 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 671 (M+1) | |

表 211

| 実施例番号 | 324 | 1H NMR (δ) ppm |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, d, J=7.9Hz), 8.30 (1H, s), 8.28 and 8.05 (2H, ABq, J=8.8 Hz), 8.16 (1H, s), 7.79 and 7.46 (2H, A'B'q, J=8.3Hz), 7.74 and 7.25 (4H, A''B''q, J=8.9Hz), 7.52 and 7.50 (4H, A'''B'''q, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, br t, J=12.1Hz), 3.80 (1H, br s), 2.39-2.18 (2H, m), 2.10-1.98 (2H, m), 1.93-1.57 (8H, m), 1.49-1.04 (8H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 662 (M+1) | |

| 実施例番号 | 325 | 1H NMR (δ) ppm |
|------------------------------------------------------------------------------------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 8.86 (1H, t, J=6.0Hz), 8.84 and 8.00 (4H, ABq, J=6.6Hz), 8.33 (1H, s), 8.27 and 8.04 (2H, A'B'q, J=9.0Hz), 8.12 (1H, s), 7.92 and 7.46 (2H, A''B''q, J=7.9Hz), 7.74 and 7.23 (4H, A'''B'''q, J=9.0Hz), 7.53 and 7.49 (4H, A''''B''''q, J=9.1 Hz), 5.13 (2H, s), 4.36 (1H, br t, J=12.8Hz), 3.70 (2H, td, J=6.8, 6.0Hz), 3.21 (2H, t, J=6.8Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 2.09-1.95 (2H, m), 1.91-1.77 (2H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.49-1.20 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 685 (M+1) | |

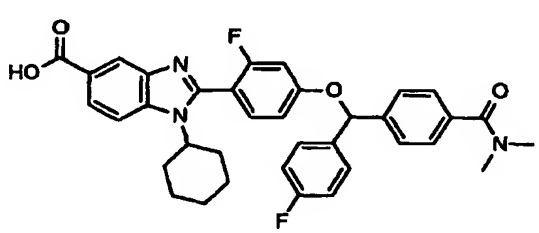
| 実施例番号 | 326 | 1H NMR (δ) ppm |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | | 300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.7Hz), 7.83 (1H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.50 (5H, m), 7.39 (2H, d, J=7.8Hz), 7.23-7.10 (3H, m), 7.05 (1H, d, J=7.8Hz), 6.85 (1H, s), 3.94 (1H, s), 2.97, 2.88 (6H, s), 2.30-2.10 (2H, m), 1.90-1.50 (5H, m), 1.40-1.00 (3H, m) |
| 純度 | > 90 % (NMR) | |
| MS | 610 (M+1) | |

表 212

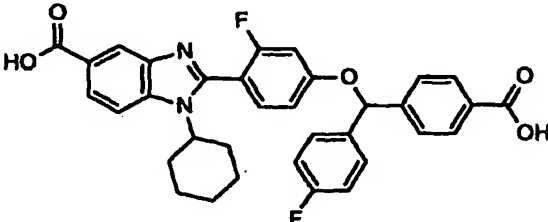
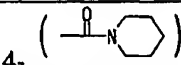
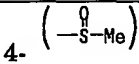
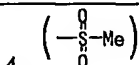
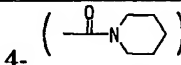
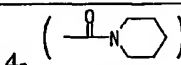
| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例番号 | 327 | 1H NMR (δ) ppm |
|  | | 300MHz, DMSO-d6 13.20-12.60 (2H, brs), 8.23 (1H, s), 7.98 (2H, d, J=6.6Hz), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70-7.50 (5H, m), 7.27-7.20 (3H, m), 7.08 (1H, d, J=7.8Hz), 6.90 (1H, s), 3.93 (1H, s), 2.51-2.05 (2H, m), 1.90-1.70 (4H, m), 1.65-1.55 (1H, m), 1.40-1.10 (3H, m) |
| 純度 | > 90% (NMR) | |
| MS | 583 (M+1) | |

表 213

| 実施例 番号 | R | R' |
|-----------|---------|----------------------------|
| 2001 | -H | 4-(-Me) |
| 2002 | -H | 3-(-CF ₃) |
| 2003 | 5-(-F) | -H |
| 2004 | 3-(-F) | 2-(-F) |
| 2005 | 3-(-F) | 3-(-F) |
| 2006 | 3-(-F) | 4-(-F) |
| 2007 | 4-(-F) | 4-(-F) |
| 2008 | 5-(-F) | 4-(-F) |
| 2009 | 6-(-F) | 4-(-F) |
| 2010 | 4-(-F) | 4-(-Cl) |
| 2011 | 5-(-F) | 4-(-Me) |
| 2012 | 5-(-F) | 4-(-CF ₃) |
| 2013 | 5-(-F) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2014 | 5-(-F) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2015 | 5-(-F) | 4- |
| 2016 | 5-(-F) | 4-(-CONH ₂) |
| 2017 | 5-(-F) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2018 | 5-(-F) | 4-(-OMe) |
| 2019 | 5-(-F) | 4-(-SMe) |
| 2020 | 5-(-F) | 4- |
| 2021 | 5-(-F) | 4- |
| 2022 | 4-(-Cl) | -H |

| | | |
|------|-------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------|
| 2023 | 4-(-Cl) | 4-(-F) |
| 2024 | 4-(-Cl) | 4-(-Cl) |
| 2025 | 4-(-Cl) | 4-(-Me) |
| 2026 | 5-(-Cl) | 4-(-CF ₃) |
| 2027 | 4-(-Cl) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2028 | 5-(-Cl) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2029 | 5-(-Cl) | 4-  |
| 2030 | 4-(-Cl) | 4-(-CONH ₂) |
| 2031 | 5-(-Cl) | 4-(-CON(Me) ₂) |
| 2032 | 5-(-Cl) | 3-(-OMe) |
| 2033 | 4-(-Cl) | 4-(-SMe) |
| 2034 | 5-(-Cl) | 4-  |
| 2035 | 4-(-Cl) | 4-  |
| 2036 | 5-(-CN) | 4-(-F) |
| 2037 | 4-(-CN) | 4-(-Cl) |
| 2038 | 5-(-NO ₂) | 4-(-F) |
| 2039 | 4-(-NO ₂) | 4-(-Cl) |
| 2040 | 5-(-Me) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2041 | 5-(-Me) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2042 | 5-(-Me) | 4-  |
| 2043 | 5-(-CF ₃) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2044 | 5-(-CF ₃) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2045 | 5-(-CF ₃) | 4-  |
| 2046 | 5-(-CO ₂ H) | 4-(-F) |
| 2047 | 4-(-CO ₂ H) | 4-(-Cl) |
| 2048 | 5-(-CO ₂ Me) | 4-(-F) |
| 2049 | 5-(-CO ₂ Me) | 4-(-Cl) |
| 2050 | 5-(-Ac) | 4-(-F) |
| 2051 | 5-(-Ac) | 4-(-Cl) |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2052 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | -H |
| 2053 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-F) |
| 2054 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2055 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CN) |
| 2056 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NO ₂) |
| 2057 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2058 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2059 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2060 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CO ₂ H) |
| 2061 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2062 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2063 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2064 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2065 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2066 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-OMe) |
| 2067 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{O---CH}_2 \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2068 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NHMe) |
| 2069 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NHAc) |
| 2070 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{N} \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2071 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2072 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2073 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2074 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$ |
| 2075 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$ |
| 2076 | 5-(-CONH ₂) | -H |
| 2077 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-F) |
| 2078 | 5-(-CONH ₂) | 2,3,4,5,6-penta-(-F) |
| 2079 | 5-(-CONH ₂) | 2-(-Cl) |
| 2080 | 5-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2081 | 3-(-CONH ₂) | 2-(-Cl) |
| 2082 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2083 | 3-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2084 | 4-(-CONH ₂) | 2-(-Cl) |
| 2085 | 4-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2086 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2087 | 6-(-CONH ₂) | 2-(-Cl) |
| 2088 | 6-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2089 | 6-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2090 | 5-(-CONH ₂) | 3,5-di-(-Cl) |
| 2091 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CN) |
| 2092 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NO ₂) |
| 2093 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-Me) |
| 2094 | 5-(-CONH ₂) | 2,6-di-(-Me) |
| 2095 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CF ₃) |
| 2096 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-Ac) |
| 2097 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2098 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CO ₂ Me) |

| | | |
|------|----------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2099 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2100 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CONH ₂) |
| 2101 | 5-(-CONH ₂) | 3,5-di-(-CONH ₂) |
| 2102 | 5-(-CONH ₂) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2103 | 5-(-CONH ₂) | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2104 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-OMe) |
| 2105 | 5-(-CONH ₂) | 3,4,5-tri-(-OMe) |
| 2106 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2107 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NHMe) |
| 2108 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NHAc) |
| 2109 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2110 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-SMe) |
| 2111 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2112 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2113 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$ |
| 2114 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$ |
| 2115 | 5-{-CON(Me) ₂ } | -H |
| 2116 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-F) |
| 2117 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Cl) |
| 2118 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CN) |
| 2119 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NO ₂) |
| 2120 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Me) |
| 2121 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CF ₃) |
| 2122 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Ac) |
| 2123 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CO ₂ H) |
| 2124 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CO ₂ Me) |

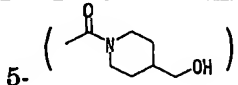
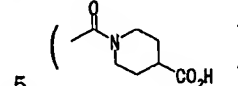
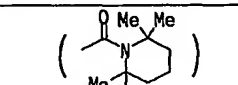
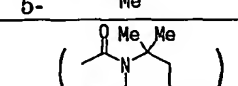
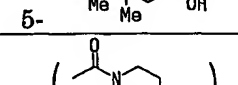
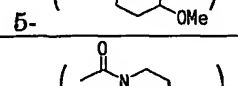
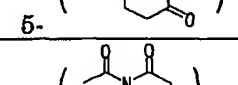
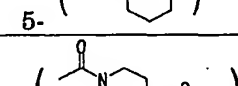
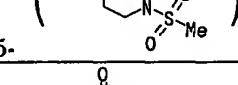
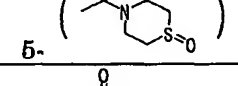
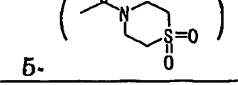
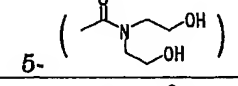
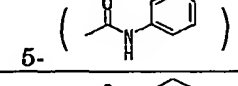
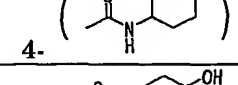
| | | |
|------|----------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2125 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2126 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 3-(-CONH ₂) |
| 2127 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2128 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2129 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-OMe) |
| 2130 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2131 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NHMe) |
| 2132 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NHAc) |
| 2133 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2134 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-SMe) |
| 2135 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2136 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2137 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$ |
| 2138 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$ |
| 2139 | 5-(-OMe) | -H |
| 2140 | 5-(-OMe) | 4-(-F) |
| 2141 | 3-(-OMe) | 4-(-Cl) |
| 2142 | 4-(-OMe) | 4-(-Cl) |
| 2143 | 5-(-OMe) | 2-(-Cl) |
| 2144 | 5-(-OMe) | 3-(-Cl) |
| 2145 | 6-(-OMe) | 4-(-Cl) |
| 2146 | 5-(-OMe) | 4-(-CN) |
| 2147 | 5-(-OMe) | 4-(-NO ₂) |
| 2148 | 5-(-OMe) | 4-(-Me) |
| 2149 | 5-(-OMe) | 4-(-CF ₃) |
| 2150 | 5-(-OMe) | 4-(-Ac) |
| 2151 | 4-(-OMe) | 4-(-CO ₂ H) |

| | | |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2152 | 4,5-di-(-OMe) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2153 | 5-(-OMe) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2154 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \right)$ |
| 2155 | 5-(-OMe) | 4-(-CONH ₂) |
| 2156 | 5-(-OMe) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2157 | 5-(-OMe) | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2158 | 5-(-OMe) | 4-(-OMe) |
| 2159 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \right)$ |
| 2160 | 5-(-OMe) | 4-(-NHMe) |
| 2161 | 5-(-OMe) | 4-(-NHAc) |
| 2162 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{---Me} \right)$ |
| 2163 | 5-(-OMe) | 4-(-SMe) |
| 2164 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---Me} \right)$ |
| 2165 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{---Me} \right)$ |
| 2166 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---NH}_2 \right)$ |
| 2167 | 5-(-OMe) | 4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---N}(\text{Me})_2 \right\}$ |
| 2168 | 5-(-NHMe) | 4-(-F) |
| 2169 | 5-(-NHMe) | 4-(-Cl) |
| 2170 | 5-(-NHAc) | 4-(-F) |
| 2171 | 5-(-NHAc) | 4-(-Cl) |
| 2172 | 5-(-NHAc) | 4-(-Ac) |
| 2173 | 5-(-NHAc) | 4-(-CONH ₂) |
| 2174 | 5-(-NHAc) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2175 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{---Me} \right)$ | 4-(-F) |
| 2176 | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{---Me} \right)$ | 4-(-Cl) |

| | | |
|------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2177 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2178 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2179 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-CO ₂ H) |
| 2180 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2181 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{C} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{N} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2182 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2183 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2184 | 5- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2185 | 5-(-SMe) | 4-(-F) |
| 2186 | 4-(-SMe) | 4-(-Cl) |
| 2187 | 5-(-SMe) | 4-(-Me) |
| 2188 | 5-(-SMe) | 4-(-CF ₃) |
| 2189 | 5-(-SMe) | 4-(-Ac) |
| 2190 | 5-(-SMe) | 4-(-CONH ₂) |
| 2191 | 5-(-SMe) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2192 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-F) |
| 2193 | 4- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2194 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2195 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2196 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2197 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2198 | 5- $\left(\text{---} \text{S} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |

| | | |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2199 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |
| 2200 | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2201 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2202 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2203 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2204 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2205 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-{(-CON(Me) ₂)} |
| 2206 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |
| 2207 | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2208 | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 2,4-di-(-Cl) |
| 2209 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2210 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 3-(-CF ₃) |
| 2211 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2212 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2213 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-{(-CON(Me) ₂)} |
| 2214 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2215 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2216 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2217 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-F) |

| | | |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2218 | 4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-Cl) |
| 2219 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-Me) |
| 2220 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-CF ₃) |
| 2221 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2222 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2223 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-SMe) |
| 2224 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ |
| 2225 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2226 | 5-{-O-(CH ₂) ₂ -OH} | 4-(-Cl) |
| 2227 | 5-{-O-(CH ₂) ₃ -OH} | 4-(-Cl) |
| 2228 | 5- $\left(\text{-O-} \begin{array}{c} \text{Cyclohexyl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2229 | 5- $\left(\text{-O-} \begin{array}{c} \text{Pyridyl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2230 | 5- $\left(\text{-O-} \begin{array}{c} \text{Thiazolyl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2231 | 5- $\left(\text{-O-} \begin{array}{c} \text{4-hydroxypiperidinyl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2232 | 5- $\left(\text{-O-} \begin{array}{c} \text{4-hydroxypiperidin-1-yl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2233 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{4-hydroxypyrrolidin-1-yl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2234 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{4-hydroxypiperidin-1-yl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2235 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{4,5-dihydroxypiperidin-1-yl} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------|---------|
| 2236 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2237 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2238 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2239 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2240 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2241 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2242 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2243 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2244 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2245 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2246 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2247 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2248 | 4-  | 4-(-Cl) |
| 2249 | 5-  | 4-(-Cl) |

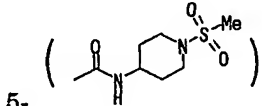
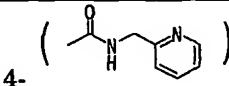
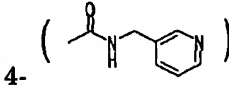
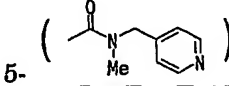
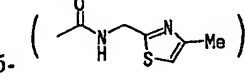
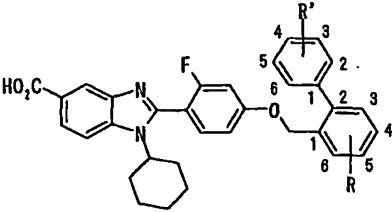
| | | |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------|---------|
| 2250 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2251 | 4-  | 4-(-Cl) |
| 2252 | 4-  | 4-(-Cl) |
| 2253 | 5-  | 4-(-Cl) |
| 2254 | 5-  | 4-(-Cl) |

表 214

|  | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|---------|--------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例 番号 | R | R' |
| 2255 | -H | -H |
| 2256 | -H | 4-(-Me) |
| 2257 | -H | 3-(-CF ₃) |
| 2258 | 5-(-F) | -H |
| 2259 | 5-(-F) | 4-(-F) |
| 2260 | 5-(-F) | 4-(-Cl) |
| 2261 | 5-(-F) | 4-(-Me) |
| 2262 | 5-(-F) | 4-(-CF ₃) |
| 2263 | 5-(-F) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2264 | 5-(-F) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2265 | 5-(-F) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2266 | 5-(-F) | 4-(-CONH ₂) |
| 2267 | 5-(-F) | 4-(-CON(Me) ₂) |
| 2268 | 5-(-F) | 4-(-OMe) |
| 2269 | 5-(-F) | 4-(-SMe) |
| 2270 | 5-(-F) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2271 | 5-(-F) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2272 | 4-(-Cl) | -H |
| 2273 | 5-(-Cl) | 4-(-F) |
| 2274 | 4-(-Cl) | 4-(-Cl) |
| 2275 | 5-(-Cl) | 4-(-Me) |
| 2276 | 5-(-Cl) | 4-(-CF ₃) |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2277 | 5-(-Cl) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2278 | 5-(-Cl) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2279 | 5-(-Cl) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2280 | 5-(-Cl) | 4-(-CONH ₂) |
| 2281 | 5-(-Cl) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2282 | 5-(-Cl) | 4-(-OMe) |
| 2283 | 5-(-Cl) | 4-(-SMe) |
| 2284 | 5-(-Cl) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2285 | 5-(-Cl) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \underset{\text{O}}{\text{S}} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2286 | 5-(-CN) | 4-(-F) |
| 2287 | 5-(-CN) | 4-(-Cl) |
| 2288 | 5-(-NO ₂) | 4-(-F) |
| 2289 | 5-(-NO ₂) | 4-(-Cl) |
| 2290 | 5-(-Me) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2291 | 5-(-Me) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2292 | 5-(-Me) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2293 | 5-(-CF ₃) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2294 | 5-(-CF ₃) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2295 | 5-(-CF ₃) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ |
| 2296 | 5-(-CO ₂ H) | 4-(-F) |
| 2297 | 4-(-CO ₂ H) | 4-(-Cl) |
| 2298 | 5-(-CO ₂ Me) | 4-(-F) |
| 2299 | 5-(-CO ₂ Me) | 4-(-Cl) |
| 2300 | 5-(-Ac) | 4-(-F) |
| 2301 | 5-(-Ac) | 4-(-Cl) |
| 2302 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ | -H |
| 2303 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$ | 4-(-F) |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2304 | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2305 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CN) |
| 2306 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NO ₂) |
| 2307 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2308 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2309 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2310 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CO ₂ H) |
| 2311 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2312 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2313 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2314 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2315 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2316 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-OMe) |
| 2317 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{O---CH}_2 \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2318 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NHMe) |
| 2319 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-NHAc) |
| 2320 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \text{N} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2321 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2322 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{Me} \right)$ |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2323 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2324 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{NH}_2 \right)$ |
| 2325 | 5- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$ |
| 2326 | 5-(-CONH ₂) | -H |
| 2327 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-F) |
| 2328 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2329 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CN) |
| 2330 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NO ₂) |
| 2331 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-Me) |
| 2332 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CF ₃) |
| 2333 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-Ac) |
| 2334 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2335 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2336 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2337 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-CONH ₂) |
| 2338 | 5-(-CONH ₂) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2339 | 5-(-CONH ₂) | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2340 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-OMe) |
| 2341 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---O---CH}_2 \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2342 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NHMe) |
| 2343 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-NHAc) |
| 2344 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2345 | 5-(-CONH ₂) | 4-(-SMe) |
| 2346 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |
| 2347 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$ |

| | | |
|------|----------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2348 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2349 | 5-(-CONH ₂) | 4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ |
| 2350 | 5-{-CON(Me) ₂ } | -H |
| 2351 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-F) |
| 2352 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Cl) |
| 2353 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CN) |
| 2354 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NO ₂) |
| 2355 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Me) |
| 2356 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CF ₃) |
| 2357 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Ac) |
| 2358 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CO ₂ H) |
| 2359 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2360 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$ |
| 2361 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-CONH ₂) |
| 2362 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2363 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2364 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-OMe) |
| 2365 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{O}-\text{CH}_2-\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$ |
| 2366 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NHMe) |
| 2367 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-NHAc) |
| 2368 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2369 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-SMe) |
| 2370 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ |
| 2371 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2372 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ |

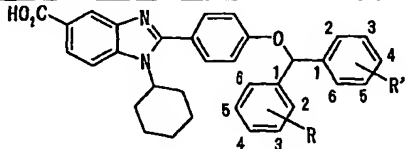
| | | |
|------|----------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2373 | 5-{-CON(Me) ₂ } | 4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ |
| 2374 | 5-(-OMe) | -H |
| 2375 | 5-(-OMe) | 4-(-F) |
| 2376 | 5-(-OMe) | 4-(-Cl) |
| 2377 | 5-(-OMe) | 4-(-CN) |
| 2378 | 5-(-OMe) | 4-(-NO ₂) |
| 2379 | 5-(-OMe) | 4-(-Me) |
| 2380 | 5-(-OMe) | 4-(-CF ₃) |
| 2381 | 5-(-OMe) | 4-(-Ac) |
| 2382 | 5-(-OMe) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2383 | 5-(-OMe) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2384 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \end{array} \right)$ |
| 2385 | 5-(-OMe) | 4-(-CONH ₂) |
| 2386 | 5-(-OMe) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2387 | 5-(-OMe) | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2388 | 5-(-OMe) | 4-(-OMe) |
| 2389 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{O}-\text{CH}_2-\text{N} \end{array} \right)$ |
| 2390 | 5-(-OMe) | 4-(-NHMe) |
| 2391 | 5-(-OMe) | 4-(-NHAc) |
| 2392 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2393 | 5-(-OMe) | 4-(-SMe) |
| 2394 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ |
| 2395 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2396 | 5-(-OMe) | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2397 | 5-(-OMe) | 4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ |
| 2398 | 5-(-NHMe) | 4-(-F) |

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2399 | 5-(-NHMe) | 4-(-Cl) |
| 2400 | 5-(-NHAc) | 4-(-F) |
| 2401 | 5-(-NHAc) | 4-(-Cl) |
| 2402 | 5-(-NHAc) | 4-(-Ac) |
| 2403 | 5-(-NHAc) | 4-(-CONH ₂) |
| 2404 | 5-(-NHAc) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2405 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |
| 2406 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2407 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2408 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2409 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CO ₂ H) |
| 2410 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2411 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---} \end{array} \right)$ |
| 2412 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2413 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2414 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---N---S---Me} \\ \quad \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2415 | 5-(-SMe) | 4-(-F) |
| 2416 | 5-(-SMe) | 4-(-Cl) |
| 2417 | 5-(-SMe) | 4-(-Me) |
| 2418 | 5-(-SMe) | 4-(-CF ₃) |
| 2419 | 5-(-SMe) | 4-(-Ac) |
| 2420 | 5-(-SMe) | 4-(-CONH ₂) |
| 2421 | 5-(-SMe) | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2422 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |

| | | |
|------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------|
| 2423 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2424 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2425 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2426 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2427 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2428 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2429 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |
| 2430 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2431 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2432 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2433 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Ac) |
| 2434 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2435 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2436 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-F) |
| 2437 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Cl) |
| 2438 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-Me) |
| 2439 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CF ₃) |
| 2440 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2441 | $\text{5-} \left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |

| | | |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2442 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4-(-SMe) |
| 2443 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2444 | 5- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2445 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-F) |
| 2446 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-Cl) |
| 2447 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-Me) |
| 2448 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-CF ₃) |
| 2449 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-CONH ₂) |
| 2450 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2451 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4-(-SMe) |
| 2452 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2453 | 5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \text{O} \end{array} \right)$ |

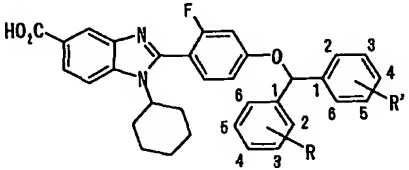
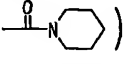
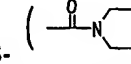
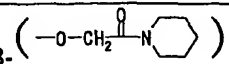
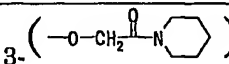
表 215

|  | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例 番号 | R | R' |
| 2454 | 2-(-F) | 2-(-F) |
| 2455 | 2-(-F) | 3-(-F) |
| 2456 | 2-(-F) | 4-(-F) |
| 2457 | 3-(-Cl) | 3-(-Cl) |
| 2458 | 3,5-di-(-Cl) | 3,5-di-(-Cl) |
| 2459 | 3-(-CN) | 3-(-CN) |
| 2460 | 3-(-NO ₂) | 3-(-NO ₂) |
| 2461 | 3-(-Me) | 3-(-Me) |
| 2462 | 3-(-CF ₃) | 3-(-CF ₃) |
| 2463 | 3-(-Ac) | 3-(-Ac) |
| 2464 | 3-(-CO ₂ H) | 3-(-CO ₂ H) |
| 2465 | 3-(-CO ₂ Me) | 3-(-CO ₂ Me) |
| 2466 | 3- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 3- $\left(\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2467 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-CONH ₂) |
| 2468 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-F) |
| 2469 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2470 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-{-CON(Me) ₂ } |
| 2471 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-(-F) |
| 2472 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-(-Cl) |
| 2473 | 3-{-C(=NH)NH ₂ } | 3-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2474 | 3-(-OMe) | 3-(-OMe) |
| 2475 | 3- $\left(\text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ | 3- $\left(\text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$ |
| 2476 | 3-(-NHMe) | 3-(-NHMe) |
| 2477 | 3-(-NHAc) | 3-(-NHAc) |

| | | |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2478 | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2479 | 3-(-SMe) | 3-(-SMe) |
| 2480 | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$ |
| 2481 | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2482 | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ | 3- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right)$ |
| 2483 | 3- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right\}$ | 3- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \\ \text{O} \end{array} \right\}$ |
| 2484 | 3-(-F) | 4-(-F) |
| 2485 | 3-(-Cl) | 4-(-Cl) |
| 2486 | 4-(-CN) | 4-(-CN) |
| 2487 | 4-(-NO ₂) | 4-(-NO ₂) |
| 2488 | 3-(-Me) | 4-(-Me) |
| 2489 | 4-(-Me) | 2,6-di-(-Me) |
| 2490 | 4-(-CF ₃) | 4-(-CF ₃) |
| 2491 | 4-(-Ac) | 4-(-Ac) |
| 2492 | 4-(-CO ₂ H) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2493 | 4-(-CO ₂ Me) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2494 | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \end{array} \right)$ | 4- $\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \end{array} \right)$ |
| 2495 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-CONH ₂) |
| 2496 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-F) |
| 2497 | 4-(-CONH ₂) | 2,3,4,5,6-penta-(-F) |
| 2498 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2499 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2500 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-F) |
| 2501 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Cl) |
| 2502 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 3,5-di-(-Cl) |
| 2503 | 4-{-C(=NH)NH ₂ } | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2504 | 4-(-OMe) | 4-(-OMe) |
| 2505 | 4-(-OMe) | 3,4,5-tri-(-OMe) |

| | | |
|------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2506 | $4-\left(-\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}\text{C}_6\text{H}_{11}\right)$ | $4-\left(-\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}\text{C}_6\text{H}_{11}\right)$ |
| 2507 | 4-(-NHMe) | 4-(-NHMe) |
| 2508 | 4-(-NHAc) | 4-(-NHAc) |
| 2509 | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{Me}\right)$ | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{Me}\right)$ |
| 2510 | 4-(-SMe) | 4-(-SMe) |
| 2511 | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{Me}\right)$ | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{Me}\right)$ |
| 2512 | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{Me}\right)$ | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{Me}\right)$ |
| 2513 | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{NH}_2\right)$ | $4-\left(-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{NH}_2\right)$ |
| 2514 | $4-\left\{-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}(\text{Me})_2\right\}$ | $4-\left\{-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}(\text{Me})_2\right\}$ |

表 216

|  | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例 番号 | R | R' |
| 2515 | -H | -H |
| 2516 | 2-(-F) | 3-(-F) |
| 2517 | 3-(-Cl) | 3-(-Cl) |
| 2518 | 3-(-CN) | 3-(-CN) |
| 2519 | 3-(-NO ₂) | 3-(-NO ₂) |
| 2520 | 3-(-Me) | 3-(-Me) |
| 2521 | 3-(-CF ₃) | 3-(-CF ₃) |
| 2522 | 3-(-Ac) | 3-(-Ac) |
| 2523 | 3-(-CO ₂ H) | 3-(-CO ₂ H) |
| 2524 | 3-(-CO ₂ Me) | 3-(-CO ₂ Me) |
| 2525 | 3- () | 3- () |
| 2526 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-CONH ₂) |
| 2527 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-F) |
| 2528 | 3-(-CONH ₂) | 3-(-Cl) |
| 2529 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-{-CON(Me) ₂ } |
| 2530 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-(-F) |
| 2531 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 3-(-Cl) |
| 2532 | 3-{-C(=NH)NH ₂ } | 3-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2533 | 3-(-OMe) | 3-(-OMe) |
| 2534 | 3- () | 3- () |
| 2535 | 3-(-NHMe) | 3-(-NHMe) |
| 2536 | 3-(-NHAc) | 3-(-NHAc) |

| | | |
|------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2537 | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{N}}-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{N}}-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ |
| 2538 | 3-(-SMe) | 3-(-SMe) |
| 2539 | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ |
| 2540 | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{Me}\right)$ |
| 2541 | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{NH}_2\right)$ | $3-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{NH}_2\right)$ |
| 2542 | $3-\left\{-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{N}(\text{Me})_2\right\}$ | $3-\left\{-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{S}}-\text{N}(\text{Me})_2\right\}$ |
| 2543 | 3-(-F) | 4-(-F) |
| 2544 | 4-(-Cl) | 4-(-Cl) |
| 2545 | 4-(-CN) | 4-(-CN) |
| 2546 | 4-(-NO ₂) | 4-(-NO ₂) |
| 2547 | 4-(-Me) | 4-(-Me) |
| 2548 | 4-(-CF ₃) | 4-(-CF ₃) |
| 2549 | 4-(-Ac) | 4-(-Ac) |
| 2550 | 3-(-CO ₂ H) | 4-(-CO ₂ H) |
| 2551 | 4-(-CO ₂ Me) | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2552 | $4-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{N}\right)$ | $4-\left(-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{N}\right)$ |
| 2553 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-CONH ₂) |
| 2554 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-F) |
| 2555 | 4-(-CONH ₂) | 4-(-Cl) |
| 2556 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 4-{-CON(Me) ₂ } |
| 2557 | 3-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-F) |
| 2558 | 4-{-CON(Me) ₂ } | 4-(-Cl) |
| 2559 | 4-{-C(=NH)NH ₂ } | 4-{-C(=NH)NH ₂ } |
| 2560 | 4-(-OMe) | 4-(-OMe) |
| 2561 | $4-\left(-\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{N}\right)$ | $4-\left(-\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{N}\right)$ |
| 2562 | 4-(-NHMe) | 4-(-NHMe) |
| 2563 | 4-(-NHAc) | 4-(-NHAc) |

| | | |
|------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2564 | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ |
| 2565 | 4-(-SMe) | 4-(-SMe) |
| 2566 | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array}\right)$ | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array}\right)$ |
| 2567 | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ |
| 2568 | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ | $4-\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array}\right)$ |
| 2569 | $4-\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \\ \text{O} \end{array}\right\}$ | $4-\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \\ \text{O} \end{array}\right\}$ |

表 217

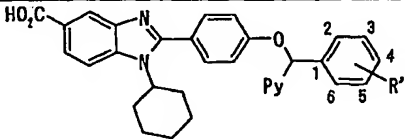
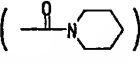
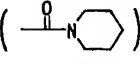
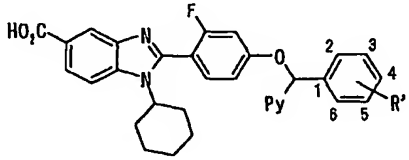
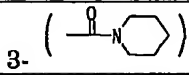
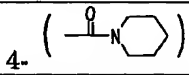
|  Py: ピリジル基 | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|------|---------------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例 番号 | Py | R' |
| 2570 | 3-Py | -H |
| 2571 | 3-Py | 3-(-F) |
| 2572 | 3-Py | 3-(-Cl) |
| 2573 | 3-Py | 3-(-Me) |
| 2574 | 3-Py | 3-(-CF ₃) |
| 2575 | 3-Py | 3-(-Ac) |
| 2576 | 3-Py | 3-(-CO ₂ H) |
| 2577 | 3-Py | 3-(-CO ₂ Me) |
| 2578 | 3-Py | 3- () |
| 2579 | 3-Py | 3-(-CONH ₂) |
| 2580 | 3-Py | 3-{-CON(Me) ₂ } |
| 2581 | 3-Py | 4-(-F) |
| 2582 | 3-Py | 4-(-Cl) |
| 2583 | 3-Py | 4-(-Me) |
| 2584 | 3-Py | 4-(-CF ₃) |
| 2585 | 3-Py | 4-(-Ac) |
| 2586 | 2-Py | 4-(-CO ₂ H) |
| 2587 | 3-Py | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2588 | 3-Py | 4- () |
| 2589 | 4-Py | 4-(-CONH ₂) |
| 2590 | 3-Py | 4-{-CON(Me) ₂ } |

表 218

|  Py: ピリジル基 | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|------|-----------------------------------------------------------------------------------------|
| 実施例 番号 | Py | R' |
| 2591 | 3-Py | -H |
| 2592 | 3-Py | 3-(-F) |
| 2593 | 3-Py | 3-(-Cl) |
| 2594 | 3-Py | 3-(-Me) |
| 2595 | 3-Py | 3-(-CF ₃) |
| 2596 | 3-Py | 3-(-Ac) |
| 2597 | 3-Py | 3-(-CO ₂ H) |
| 2598 | 3-Py | 3-(-CO ₂ Me) |
| 2599 | 3-Py | 3-  |
| 2600 | 3-Py | 3-(-CONH ₂) |
| 2601 | 3-Py | 3-{-CON(Me) ₂ } |
| 2602 | 3-Py | 4-(-F) |
| 2603 | 3-Py | 4-(-Cl) |
| 2604 | 3-Py | 4-(-Me) |
| 2605 | 3-Py | 4-(-CF ₃) |
| 2606 | 3-Py | 4-(-Ac) |
| 2607 | 3-Py | 4-(-CO ₂ H) |
| 2608 | 3-Py | 4-(-CO ₂ Me) |
| 2609 | 3-Py | 4-  |
| 2610 | 3-Py | 4-(-CONH ₂) |
| 2611 | 3-Py | 4-{-CON(Me) ₂ } |

以下に製剤例を挙げるが、これに限定されるものではない。

製剤例

| | |
|------------------------|-------|
| (a) 実施例 1 の化合物 | 1 0 g |
| (b) 乳糖 | 5 0 g |
| (c) トウモロコシデンプン | 1 5 g |
| (d) カルボキシメチルセルロースナトリウム | 4 4 g |
| (e) ステアリン酸マグネシウム | 1 g |

(a)、(b)、(c)の全量及び(d)の30gを水で練合し、真空乾燥後、製粒を行う。この製粒末に14gの(d)及び1gの(e)を混合し、打錠機で錠剤とすることにより、1錠あたり10mgの(a)を含有する錠剤1000個を製造する。

産業上の利用可能性

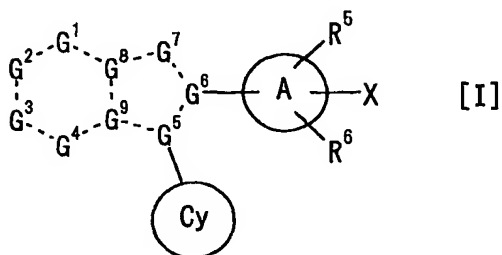
上記結果から明らかな様に、本発明の化合物はHCVポリメラーゼに対し高い阻害活性を示す。

よって、これら化合物は、HCVポリメラーゼ阻害活性により抗HCV作用を示すC型肝炎の予防若しくは治療に有効な薬剤となり得る。また、インターフェロン等の他の抗HCV剤及び／又は他の抗炎症剤等との併用によりC型肝炎の予防若しくは治療により有効な薬剤となり得る。また、HCVポリメラーゼに特異的な高い阻害活性を有することは、人体に対し安全な副作用の少ない薬剤となり得ることを示す。

本出願は、日本で出願された平成11年特許願第369008号を基礎としており、その内容は本明細書に包含されるものである。

請求の範囲

1. 下記一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成るC型肝炎治療剤。



[式中、破線は単結合又は二重結合であり、
 G^1 は、 $C(-R^1)$ 又は窒素原子であり、
 G^2 は、 $C(-R^2)$ 又は窒素原子であり、
 G^3 は、 $C(-R^3)$ 又は窒素原子であり、
 G^4 は、 $C(-R^4)$ 又は窒素原子であり、
 G^5 、 G^6 、 G^8 及び G^9 は、それぞれ独立して、炭素原子又は窒素原子であり、
 G^7 は、 $C(-R^7)$ 、酸素原子、硫黄原子、又は R^8 で置換されてもよい窒素原子であり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2) C1-6アルカノイル基、
- (3)カルボキシ基、
- (4)シアノ基、
- (5)ニトロ基、
- (6)下記グループAから選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C1-6アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシカルボニル基及びC1-6アルキルアミノ基。

- (7) - COOR^{al},

ここでR^{al}は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリー

ル C1-6アルキル基を意味する。

グループ B ; ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化 C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又は C1-6アルキル基を意味し、 r は 0 又は 1 乃至 6 の整数である。

(8) $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで R^{a2} 及び R^{a3} は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9) $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで R^{a4} は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10) $-NHR^{a5}$ 、

ここで R^{a5} は、水素原子、C1-6アルカノイル基又は C1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11) $-OR^{a6}$ 、

ここで R^{a6} は、水素原子又は置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12) $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで R^{a7} は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又は C1-6アルキルアミノ基を意味する。

又は、

(13) $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6アルキル基を意味する。

であり、

R^7 及び R^8 は、水素原子又は置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の

通り。)であり、

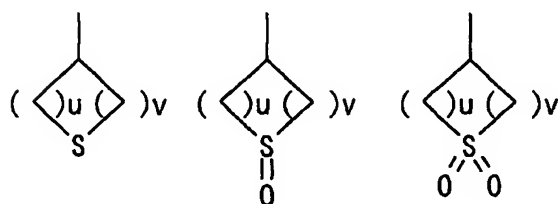
環Cyは、

(1)下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

グループC；水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。

(2)前記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルケニル基又は、

(3)



(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、
環Aは、

(1)C6-14アリール基、

(2)C3-8シクロアルキル基、

(3)C3-8シクロアルケニル基、又は、

(4)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

R⁶及びR⁶は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)ハロゲン原子、

(3)置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4)-OR^{a8}

ここでR^{a8}は、水素原子、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

であり、

Xは、

- (1)水素原子、
- (2)ハロゲン原子、
- (3)シアノ基、
- (4)ニトロ基、
- (5)アミノ基、C1-6アルカノイルアミノ基、
- (6)C1-6アルキルスルホニル基、
- (7)置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (8)前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC2-6アルケニル基、
- (9) $-COOR^{a9}$ 、

ここで R^{a9} は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

- (10) $-CONH-(CH_2)_1-R^{a10}$ 、

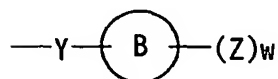
ここで R^{a10} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、C1-6アルコキシカルボニル基又はC1-6アルカノイルアミノ基であり、1は、0又は1乃至6の整数を意味する。

- (11) $-OR^{a11}$ 、

ここで R^{a11} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

又は、

- (12)



{式中、環Bは、

- (1') C6-14アリール基、
- (2') C3-8シクロアルキル基、又は、
- (3') ヘテロ環基（前記定義の通り。）であり、

Zは、それぞれ独立して、

- (1') 下記グループDから選ばれる基、
- (2') 下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-

14アリール基、

(3') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、

(4') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基、又は、

(5') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

グループD：

(a)水素原子、

(b)ハロゲン原子、

(c)シアノ基、

(d)ニトロ基、

(e)置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(f) $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、t は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

ここで R^{a18} は、

(1'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(2'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、又は、

(3'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

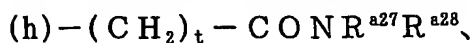
ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、

(g) $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで R^{a19} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14

アリール C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a27} 及び R^{a28} は、それぞれ独立して、

(1'') 水素原子、

(2'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(3'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、

(4'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基、

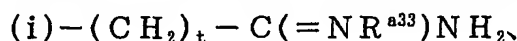
(5'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、

(6'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環 C1-6アルキル基、

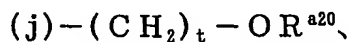
ここで当該ヘテロ環 C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6アルキル基を意味する。

(7'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、又は

(8'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル C1-6アルキル基であり、



ここで R^{a33} は、水素原子又は C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a20} は、

(1'') 水素原子、

(2'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。） 、

(3'') 置換されてもよい C2-6アルケニル基（前記定義の通り。） 、

(4'') 前記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C2-6アルキニル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

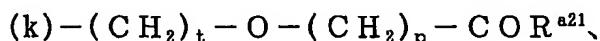
(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

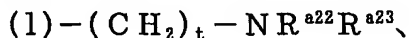
(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、又は

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、



ここで R^{a21} は、C1-6アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、 p は0又は1乃至6の整数を意味する。



ここで R^{a22} 及び R^{a23} は、それぞれ独立して、

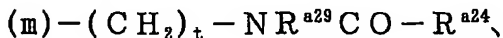
(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

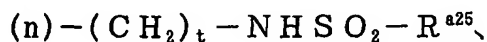
(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、又は、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基であり、

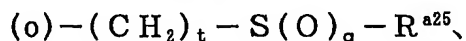


ここで R^{a29} は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、 R^{a24} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループ

Bから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

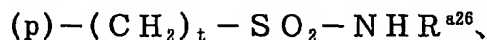


ここで R^{a25} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで R^{a25} は前記定義の通りであり、 q は 0、1 又は 2 である。

及び、



ここで R^{a26} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

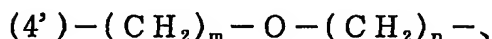
w は、1 乃至 3 の整数であり、

Y は、

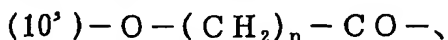
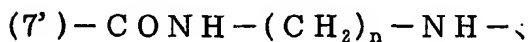
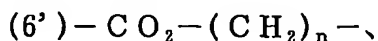
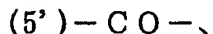
(1') 単結合、

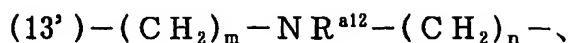
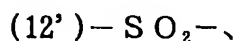
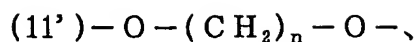
(2') C1-6アルキレン、

(3') C2-6アルケニレン、



以下、 m 及び n は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。





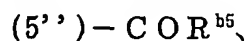
ここで R^{a12} は、

(1'') 水素原子、

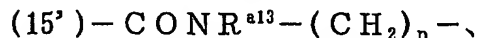
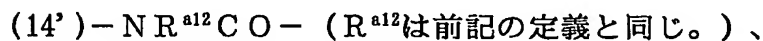
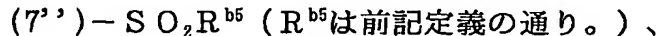
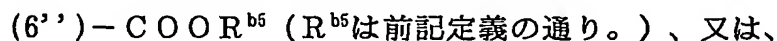
(2'') 置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基、

(4'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、



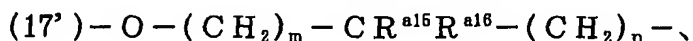
ここで R^{b5} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール C1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a14} は、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基を意味する。



ここで R^{a15} 及び R^{a16} は、それぞれ独立して、

(1'') 水素原子、

(2'') カルボキシ基、

(3'') C1-6アルキル基、

(4'')-OR^{b6}、

ここでR^{b6}は、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

又は、

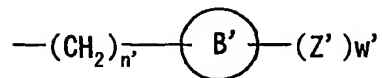
(5'')-NHR^{b7}

ここでR^{b7}は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR^{a16}は、

(6'')



であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18')-(CH₂)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-(R^{a12}及びR^{a15}は、それぞれ前記定義の通り。)、

(19')-NR^{a17}SO₂-

ここでR^{a17}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(20')-S(O)_e-(CH₂)_m-CR^{a16}R^{a16}-(CH₂)_n-(eは0、1又は2であり、R^{a16}及びR^{a16}は、それぞれ前記定義の通り。)

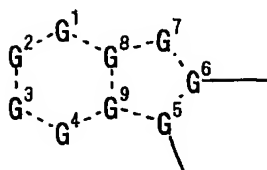
である。}である。]

2. G¹、G²、G³、G⁴、G⁵、G⁶、G⁷、G⁸及びG⁹のうち1乃至4個が窒素原子である請求項1記載のC型肝炎治療剤。

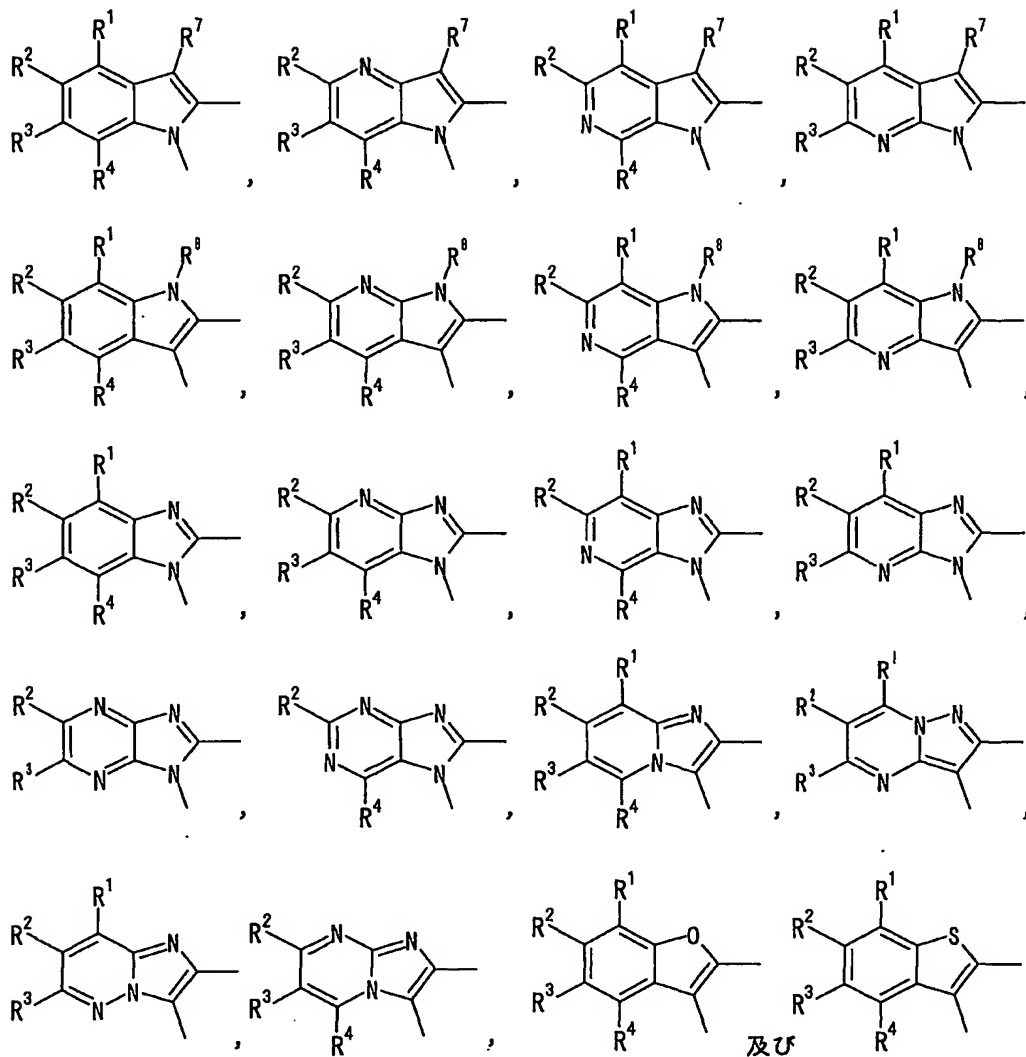
3. G²がC(-R²)であり、G⁶が炭素原子である請求項2記載のC型肝炎治療剤。

4. G⁵が窒素原子である請求項2又は請求項3記載のC型肝炎治療剤。

5. 一般式 [I] の

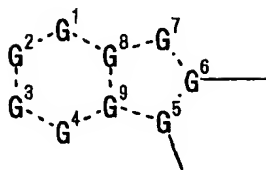


部位が、

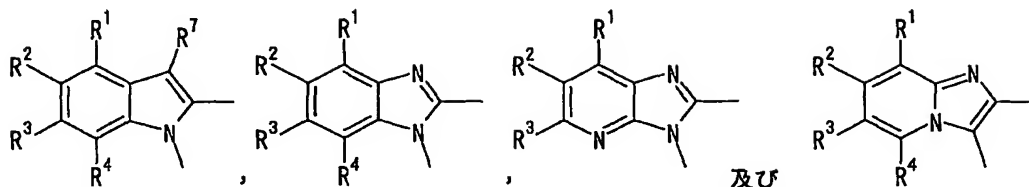


からなる群より選ばれる縮合環である請求項 1 記載の C 型肝炎治療剤。

6. 一般式 [I] の

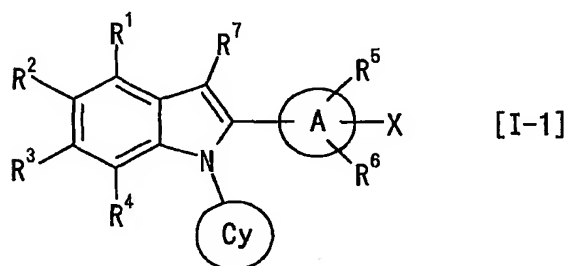


部位が、



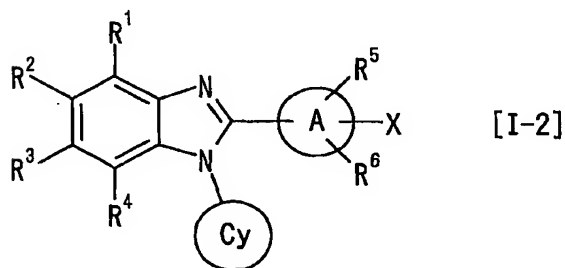
からなる群より選ばれる縮合環である請求項 5 記載の C 型肝炎治療剤。

7. 下記一般式 [I-1] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

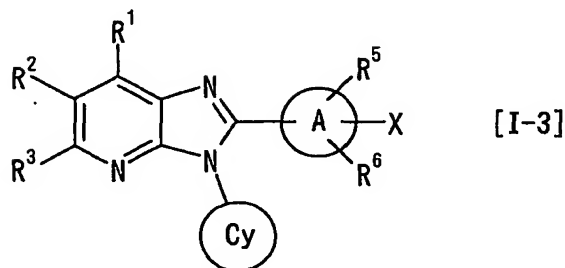
8. 下記一般式 [I-2] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

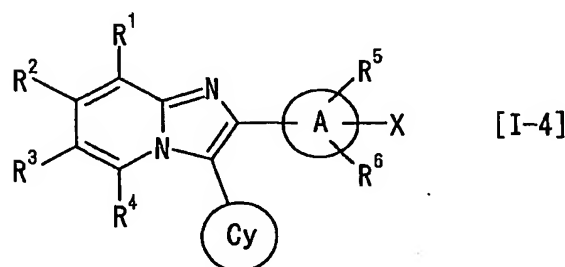
9. 下記一般式 [I-3] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその

塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

10. 下記一般式 [I-4] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



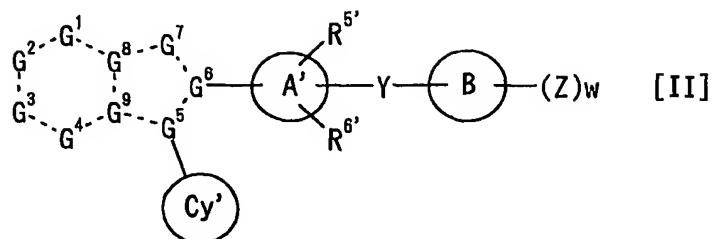
(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

11. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 又は $-SO_2R^{a7}$ (R^{a1} 、 R^{a2} 、 R^{a3} 及び R^{a7} は請求項 1 記載の通りである。)である請求項 1 乃至 10 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

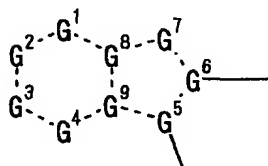
12. 環 Cy が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である請求項 1 乃至 11 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

13. 環 A が、C6-14アリール基である請求項 1 乃至 12 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

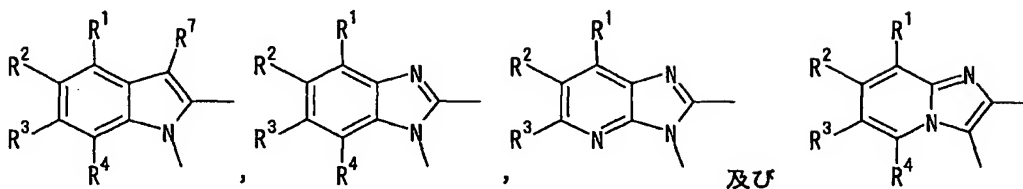
14. 下記一般式 [II] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



[式中、



部位は、



からなる群より選ばれる縮合環であり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)C1-6アルカノイル基、

(3)カルボキシ基、

(4)シアノ基、

(5)ニトロ基、

(6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシカルボニル基及びC1-6アルキルアミノ基。

(7) $-COOR^{a1}$ 、

ここで R^{a1} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリー

ルC1-6アルキル基を意味する。

グループB ; ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{b1} 及び R^{b2} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 r は0又は1乃至6の整数である。

(8) $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで R^{a2} 及び R^{a3} は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9) $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで R^{a4} は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10) $-NHR^{a5}$ 、

ここで R^{a5} は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11) $-OR^{a6}$ 、

ここで R^{a6} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12) $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで R^{a7} は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

又は、

(13) $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

であり、

R^7 は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）

であり、

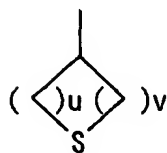
環C_y'は、

(1)下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基

グループC；水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。

又は、

(2)



(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、
環A'は、

(1)フェニル基、ビリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれる基であり、

R^{6a}及びR^{6b}は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)ハロゲン原子、

(3)置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4)水酸基

であり、

環Bは、

(1)C6-14アリール基、

(2)C3-8シクロアルキル基、又は、

(3)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

Zは、それぞれ独立して、

(1)下記グループDから選ばれる基、

- (2)下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、
- (3)下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、
- (4)下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6アルキル基、又は、
- (5)下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含む。

グループD：

- (a)水素原子、
- (b)ハロゲン原子、
- (c)シアノ基、
- (d)ニトロ基、
- (e)置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (f) $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、t は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

ここで R^{a18} は、

- (1')置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）、
- (2')前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、又は、
- (3')前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

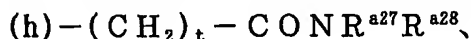
ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含む。

であり、

- (g) $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで R^{a19} は、水素原子、置換されてもよい C1-6アルキル基（前記定義の通り。）

又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a27} 及び R^{a28} は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

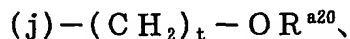
ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、又は

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、



ここで R^{a33} は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。



ここで R^{a20} は、

(1')水素原子、

(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3')置換されてもよいC2-6アルケニル基（前記定義の通り。）、

(4')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC

2-6アルキニル基、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリール基、

(6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリールC1-6アルキル基、

(7')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環基、

(8')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環C1-6アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキル基、又は

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい
C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、

(k)-(CH₂)_t-O-(CH₂)_p-COR^{a21}、

ここでR^{a21}は、C1-6アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至
5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは0又は1乃至6の整数
を意味する。

(l)-(CH₂)_t-NR^{a22}R^{a23}、

ここでR^{a22}及びR^{a23}は、それぞれ独立して、

(1')水素原子、

(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリール基、

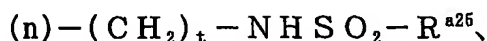
(4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC
6-14アリールC1-6アルキル基、又は、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘ
テロ環C1-6アルキル基であり、

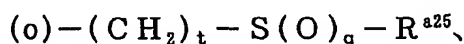
(m)-(CH₂)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}、

ここでR^{a29}は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

R^{a24} は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

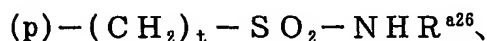


ここで R^{a25} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで R^{a25} は前記定義の通りであり、 q は0、1又は2である。

及び、



ここで R^{a26} は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

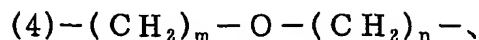
w は、1乃至3の整数であり、

Y は、

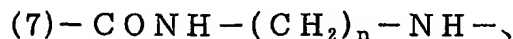
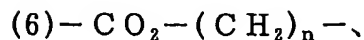
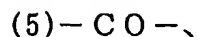
(1)単結合、

(2)C1-6アルキレン、

(3)C2-6アルケニレン、



以下、 m 及び n は、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。



(10) $-\text{O}-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}-$ 、

(11) $-\text{O}-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 、

(12) $-\text{SO}_2-$ 、

(13) $-(\text{CH}_2)_m-\text{NR}^{\text{a12}}-(\text{CH}_2)_n-$ 、

ここで R^{a12} は、

(1') 水素原子、

(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(4') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(5') $-\text{COR}^{\text{b5}}-$ 、

ここで R^{b5} は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(6') $-\text{COOR}^{\text{b5}}$ (R^{b5} は前記定義の通り。)、又は、

(7') $-\text{SO}_2\text{R}^{\text{b5}}$ (R^{b5} は前記定義の通り。)、

(14) $-\text{NR}^{\text{a12}}\text{CO}-$ (R^{a12} は前記の定義と同じ。)、

(15) $-\text{CONR}^{\text{a13}}-(\text{CH}_2)_n-$ 、

ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。) 又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(16) $-\text{CONH}-\text{CHR}^{\text{a14}}-$ 、

ここで R^{a14} は、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基を意味する。

(17) $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CR}^{\text{a15}}\text{R}^{\text{a16}}-(\text{CH}_2)_n-$ 、

ここで R^{a15} 及び R^{a16} は、それぞれ独立して、

(1') 水素原子、

(2')カルボキシル基、

(3')C1-6アルキル基、

(4')-OR^{b6}、

ここでR^{b6}は、C1-6アルキル基又はC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

又は、

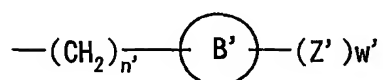
(5')-NHR^{b7}

ここでR^{b7}は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリアルC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR^{a15}は、

(6')



であつてもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18)-(CH₂)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-(R^{a12}及びR^{a15}は、それぞれ前記定義の通り。)、

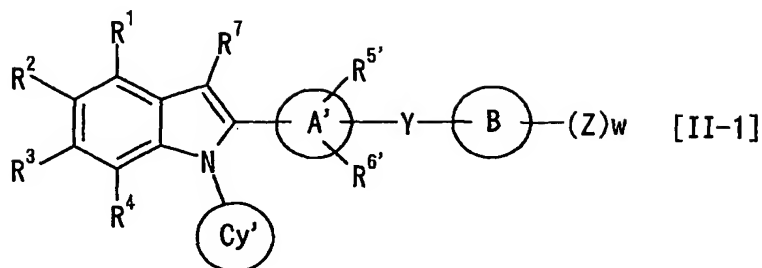
(19)-NR^{a17}SO₂-、

ここでR^{a17}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

又は、

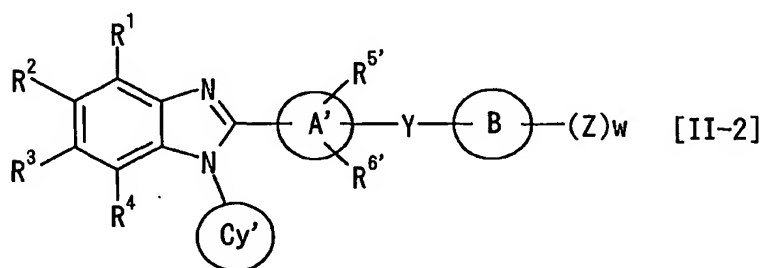
(20)-S(O)_e-(CH₂)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH₂)_n-(eは0、1又は2であり、R^{a15}及びR^{a16}は、それぞれ前記定義の通り。)である。]

15. 下記一般式[II-1]で表される請求項14記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



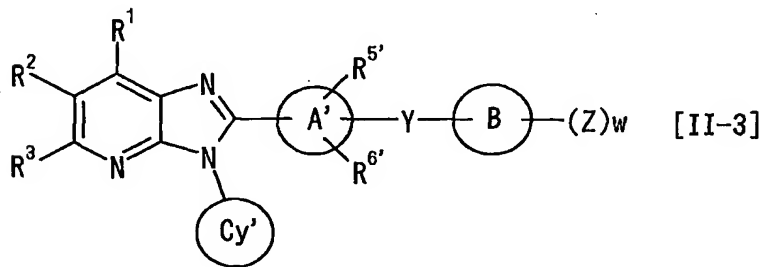
(式中、各記号は請求項 1 4 記載の通りである。)

16. 下記一般式 [II-2] で表される請求項 1 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



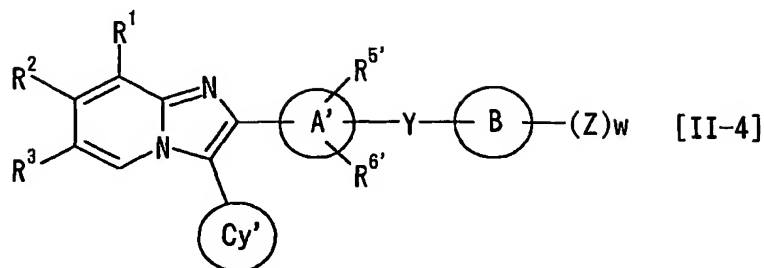
(式中、各記号は請求項 1 4 記載の通りである。)

17. 下記一般式 [II-3] で表される請求項 1 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は請求項 1 4 記載の通りである。)

18. 下記一般式 [II-4] で表される請求項 1 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は請求項 1 4 記載の通りである。)

19. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、 $-COOR^{a1}$ 又は $-SO_2R^{a7}$ (ここで R^{a1} 及び R^{a7} は請求項 1 4 記載の通り。)である請求項 1 4 乃至 1 8 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

20. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基又は $-COOR^{a1}$ (ここで R^{a1} は請求項 1 4 記載の通り。)である請求項 1 9 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

21. R^2 がカルボキシル基であり、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子である請求項 20 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

22. 環 Cy' が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である請求項 1 4 乃至 2 1 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

23. 環 Cy' が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基である請求項 2 2 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

24. 環 A' が、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基である請求項 1 4 乃至 2 3 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

25. 環 A' が、フェニル基又はピリジル基である請求項 2 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

26. 環 A' が、フェニル基である請求項 2 5 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

27. Y が、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CH$
 $R^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(C$

$\text{H}_2)_m - \text{CR}^{\text{a15}}\text{R}^{\text{a16}} - (\text{CH}_2)_n -$ 又は $-(\text{CH}_2)_n - \text{NR}^{\text{a12}} - \text{CHR}^{\text{a15}} -$ (ここで各記号は請求項14記載の通り。)である請求項14乃至26のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

28. Yが、 $-(\text{CH}_2)_m - \text{O} - (\text{CH}_2)_n -$ 又は $-\text{O} - (\text{CH}_2)_m - \text{CR}^{\text{a15}}\text{R}^{\text{a16}} - (\text{CH}_2)_n -$ (ここで各記号は請求項14記載の通り。)である請求項27記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

29. Yが、 $-(\text{CH}_2)_m - \text{O} - (\text{CH}_2)_n -$ (ここで各記号は請求項14記載の通り。)である請求項28記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

30. R^2 がカルボキシル基であり、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、環 Cy' がシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、環 A' がフェニル基である請求項14乃至29のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

31. 2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フ

エニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [(E) - 2 - フェニルビニル] フェニル }
ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [(E) - 2 - フェニルビニル] フェニル }
ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミド、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - シアノ - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミドオキシム、

1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [{ 4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 5 - チアゾリル } メトキシ] フェニル } ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [{ 4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 5 - チアゾリル } メトキシ] フェニル } ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - { 4 - [ビス (3 - フルオロフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

2 - { 4 - [ビス (3 - フルオロフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンゾイルアミノフェニル) - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

2 - (4 - ベンゾイルアミノフェニル) - 1 - シクロベンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - { 4 - [3 - (3 - クロロフェニル) フェノキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

2 - {4 - [3 - (3 - クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - [4 - (3 - アセトキシフェニルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (3 - ヒドロキシフェニルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (4 - ビリジイルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (4 - ビリジイルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - N, N - ジメチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミド、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - N - メトキシ - N - メチルベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミド、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - 5 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) ベンゾイミダゾール、

5 - アセチル - 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - N - (2 - ジメチルアミノエチル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボキサミド 二塩酸塩、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - 5 - ニトロベンゾイミダゾール、

5 - アミノ - 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール 塩酸塩、

5 - アセチルアミノ - 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペン

チルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-メタンスルホニルアミノベンゾイミダゾール、

5-スルファモイル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-[4-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-カルボキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(2-クロロ-5-チエニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-ピリジルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-{4-[(3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル)メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-イル]カルボニルアミノ酢酸、

2-[4-(2-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(ベンゼンスルホニルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3,5-ジクロロフェニルカルボニルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-クロロフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-tert-ブチルフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-ベンジルオキシフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

trans-4-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]シクロヘキサン-1-オール、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-メトキシシクロヘキサン、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメチル-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-[(4-シクロヘキシルフェニル)カルボニルアミノ]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3,5-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(フェニルカルバモイルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-(4-フェネチルオキシフェニル)ベンゾイミダゾール

ール-5-カルボン酸、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-tert-ブチルシクロヘキサン、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメトキシ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(N-ベンゼンスルホニル-N-メチルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-(4-フェネチルフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,5-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,5-ジ-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(4-メチルシクロヘキシル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-ナフチル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(1-ナフチル)メトキシフェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(ジベンジルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ピフェニルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (ジベンジルメトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンゾイルメトキシフェニル) - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (3, 3 - ジフェニルプロピルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - [4 - (3 - クロロ - 6 - フェニルベンジルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [2 - (フェノキシ) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (3 - フェニルプロピルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (5 - フェニルペンチルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (2 - ベンジルオキシ - 5 - ピリジル) - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [2 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - (4, 4 - ジメチルシクロヘキシル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [2 - (1 - ナフチル) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - [4 - (2 - ベンジルオキシフェノキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - [4 - (3 - ベンジルオキシフェノキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

1 - シクロヘキシル - 2 - [4 - (2 - ヒドロキシフェノキシ) フェニル] ベ

ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ[b, f]アゼピン-5-イル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-メトキシフェニル)エトキシ]

フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メトキシフェニル)エトキシ]
フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロヘプチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェネチルオキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェネチルオキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2,2-ジフェニルエトキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

cis-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-フルオロシクロヘキサン、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェノキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェノキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(2R)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-2-フェニルエトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{2-フルオロ-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-メチルフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-フルオロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-メトキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-ヒドロキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-メチル-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(2-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(3-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メトキシフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{2-メチル-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-tert-ブチルフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(3,5-ジクロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-2-クロロフェニル}-1-

シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) -2-トリフルオロメチルフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (2-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(2R) -2-アミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (2-ビフェニリルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (3-ビフェニリルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- { (1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- { (1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (3, 4, 5-トリメトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (2-ビフェニリル) エトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (2-ビフェニリルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (4-ピペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-ピペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [(2R) -2-アセチルアミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル}

- ル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-メチル-3-ベンテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-3-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[{(2S)-1-ベンジル-2-ピロリジニル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(4-メチルチオフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(4-メタンスルホニルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(2-チエニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(3-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(3-ピリジル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(4-フルオロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-3-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-[4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-クロロ-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[2-{(1-アセチル-4-ピペリジル)メトキシ}フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[3-{(1-アセチル-4-ピペリジル)メトキシ}フェノキシ]

- フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (2 - プロピニルオキシ) フェノキシ]
フェニル } ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (3 - ピリジルメトキシ) フェノキシ]
フェニル } ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - (4 - ベンジルオキシ - 2 - メトキシフェニル) - 1 - シクロヘキシルベ
ンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - [4 - (2 - ブロモ - 5 - メトキシベンジルオキシ) フェニル] - 1 - シ
クロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - [4 - (カルボキシジフェニルメトキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシ
ルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ニトロベンジルオキシ] フェ
ニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [3 - アセチルアミノ - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ
] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [2 - (4 - カルボキシフェニル) - 5 - クロロベンジルオキシ]
フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [{ (2 S) - 1 - ベンジルオキシカルボニル - 2 - ピロリジニル }
メトキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン
酸、
- 2 - { 2 - クロロ - 4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ベンジル
オキシ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (2 - ピリジルメトキシ) フェノキシ]
フェニル } ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - フルオロベンジルオキシ] フェ
ニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [3 - カルボキシ - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ]
フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [3 - カルバモイル - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ]

- フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [2 - (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [2 - (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [{ (2S) - 1 - ベンゼンスルホニル - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [{ (2S) - 1 - ベンゾイル - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [2 - (4 - カルバモイルフェニル) - 5 - クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - { (1 - メタンスルホニル - 4 - ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [{ 2 - メチル - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - オキサゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [3 - (3 - クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 2 - { 4 - [3 - (4 - クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [3 - (4 - フルオロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、
- 1 - シクロヘキシル - 2 - { 4 - [{ (2S) - 1 - (4 - ニトロフェニル) - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン

酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[{(2S)-1-フェニル-2-ピロリジニル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[{(2S)-1-(4-アセチルアミノフェニル)-2-ピロリジニル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[{5-(4-クロロフェニル)-2-メチル-4-チアゾリル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-3-ニトロベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-テトラヒドロピラニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-{(1-メチル-4-ピペリジル)メトキシ}フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(2-クロロベンジルオキシ)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-ピリジル)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(4-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-メトキシフェニル)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-メタンスルホニルフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [1- (4-クロロベンジル) -3-ピペリジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- { (2-メチル-4-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- { (2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3, 5-ジクロロフェニル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [1- (4-クロロベンジル) -4-ピペリジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [4-カルバモイル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [4- (4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- { (2-クロロ-4-ピリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{ (2S) -1- (4-ジメチルカルバモイルフェニル) -2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-エトキシカルボニルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-ジメチルカルバモイルフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[{4-(4-クロロフェニル)-2-メチル-5-ピリミジニル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[{2-(4-クロロフェニル)-3-ピリジル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2-{4-[{3-(4-クロロフェニル)-2-ピリジル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(3-クロロフェニル)-4-メチルアミノ-1,3,5-トリアジン-6-イルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-4-(5-テトラゾリル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-ベンジルオキシ-6-ピリミジニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[4-(4-ピリジルメトキシ)-6-ピリミジニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[4-(3-クロロフェニル)-6-ピリミジニルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエス

テル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2- [4- (2-ブロモ-5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [5-tert-ブトキシカルボニル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3- (tert-ブチルスルファモイル) -6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-スルファモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩、

2- (4-ベンジルオキシシクロヘキシル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[2-(2-ビフェニルオキシメチル)-5-チエニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[2-(2-ビフェニルオキシメチル)-5-フリル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシメチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-カルボキシフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{2-フルオロ-4-[4-フルオロ-2-(3-フルオロベンゾイル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-3-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-5-(4-ピリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-カルボキシ-5-(4-ピリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸、

2-{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[{2-(4-カルボキシフェニル)-3-ピリジル}メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フ

エニル} - 1 - (4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2 - {4 - [3-ジメチルカルバモイル-6 - (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2 - {4 - [3-ジメチルカルバモイル-6 - (4-メチルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [3-カルバモイル-6 - (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [3-ジメチルカルバモイル-6 - (4-メタンスルホニルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [3-ジメチルカルバモイル-6 - (3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2 - {4 - [3-ジメチルカルバモイル-6 - (4-ジメチルカルバモイルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - (4 - テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ジメチルスルファモイルベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メタンスルホニルベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - {4 - [5 - カルボキシ - 2 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ジメチルアミノベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メタンスルホニルアミノベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ジエチルカルバモイルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - イソプロピルカルバモイルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ピペリジノカルボニルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (1 - ピロリジニル) カルボニルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 - ヒドロキシエチル) カルバモイルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジノ) カルボニルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - モルホリノカルボニルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - チオモルホリノカルボニルベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [3 - (カルボキシメチルカルバモイル) - 6 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - {4 - (2 - カルボキシエチル) フェニル} - 5 - クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - {4 - [3 - クロロ - 6 - (4 - ヒドロキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [3 - クロロ - 6 - (4 - メトキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (3 - カルボキシフェニル) - 5 - クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルチオベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルスルフィニルベンジル

- オキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-シアノベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- 2-{4-[ビス(3-ピリジル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[ビス(4-ジメチルカルバモイルフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[2-チエニル-3-チエニルメトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩、
- 2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ジメチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、
- 2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ジメチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩、
- 2-{4-[5-カルボキシ-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[2-(4-カルボキシフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[2-(4-カルバモイルフェニル)-5-(ジメチルカルバモイル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[5-アミノ-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
- 2-{4-[5-(4-クロロフェニル)-2-メトキシベンジルスルフィニル]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- 2-{4-[5-(4-クロロフェニル)-2-メトキシベンジルスルホニル]}

フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルチオ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[ビス(4-カルボキシフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
2-{4-[フェニル-3-ピリジルメトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(メチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、
2-{4-[5-クロロ-2-(4-ピリジル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ベンジルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(シクロヘキシルメチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-ピリジルメチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(N-ベンジル-N-メチルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸メチルエステル、
2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フ

- エニル} - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸、
2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 1 - シクロペンチル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸、
2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボン酸エチルエステル、
2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボン酸、及び
2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 3 - シクロヘキシル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 6 - カルボン酸からなる群より選ばれる請求項 1 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
32. 請求項 1 4 乃至 31 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る医薬組成物。
33. 請求項 1 乃至 31 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る C 型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤。
34. 請求項 1 乃至 31 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る抗 C 型肝炎ウイルス剤。
35. 請求項 1 4 乃至 31 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る C 型肝炎治療剤。
36. 有効量の請求項 1 記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C 型肝炎の治療方法。
37. 有効量の請求項 1 記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C 型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害方法。
38. C 型肝炎治療用医薬を製造するための請求項 1 記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。
39. C 型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤を製造するための請求項 1 記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

40. 請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎治療用医薬組成物。

41. 請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害用医薬組成物。

42. 請求項40記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎の治療用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

43. 請求項41記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/09181

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/12, 235/18, 235/30, 401/04, 401/10, 401/12, 401/14, 403/12, 405/04, 405/12, 409/04, 409/12, 409/14, C07D413/04, 413/12, 417/12, 471/04, 487/04, A61K31/407, 417B, 4184, 422, 427, 428, 433, 437, 4439, 454, 4709, A61K31/4725, 496, 498, 506, 53, 5377, 541, 55, A61P1/16, 31/20

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/12, 235/18, 235/30, 401/04, 401/10, 401/12, 401/14, 403/12, 405/04, 405/12, 409/04, 409/12, 409/14, C07D413/04, 413/12, 417/12, 471/04, 487/04, A61K31/407, 417B, 4184, 422, 427, 428, 433, 437, 4439, 454, 4709, A61K31/4725, 496, 498, 506, 53, 5377, 541, 55, A61P1/16, 31/20

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| A | WO, 97/46237, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 11 December, 1997 (11.12.97), & CA, 2257296, A & AU, 9732128, A & EP, 906097, A1 & CN, 1220601, A & BR, 9709528, A & JP, 2000-511899, A | 1-35, 38-43 |
| A | EP, 507650, A1 (SYNTHELABO S.A.), 07 October, 1992 (07.10.92), & FR, 2674855, A & CA, 2064924, A & NO, 9201281, A & AU, 9213989, A & CN, 1065459, A & JP, 5-112563, A & HU, 62573, A & US, 5280030, A | 1-35, 38-43 |
| A | WO, 97/25316, A1 (GLAXO GROUP LMT.), 17 July, 1997 (17.07.97), & AU, 9714389, A & NO, 9803089, A & CZ, 9802127, A & EP, 886635, A1 & BR, 9706938, A & HU, 9900580, A & US, 5998398, A & CN, 1212683, A & JP, 2000-503017, A & KR, 9907740, A | 1-35, 38-43 |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
 "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
 "E" earlier document but published on or after the international filing date
 "I" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
 "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
 "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
 "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
20 February, 2001 (20.02.01)

Date of mailing of the international search report
06 March, 2001 (06.03.01)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/09181

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 36,37
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
The inventions of claims 36 and 37 fall under the category of methods for treatment of the human body by therapy.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/12, 235/18, 235/30, 401/04, 401/10, 401/12, 401/14, 403/12, 405/04, 405/12, 409/04, 409/12, 409/14, C07D413/04, 413/12, 417/12, 471/04, 487/04, A61K31/407, 4178, 4184, 422, 427, 428, 433, 437, 4439, 454, 4709, A61K31/4725, 496, 498, 506, 53, 5377, 541, 55, A61P1/16, 31/20

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/12, 235/18, 235/30, 401/04, 401/10, 401/12, 401/14, 403/12, 405/04, 405/12, 409/04, 409/12, 409/14, C07D413/04, 413/12, 417/12, 471/04, 487/04, A61K31/407, 4178, 4184, 422, 427, 428, 433, 437, 4439, 454, 4709, A61K31/4725, 496, 498, 506, 53, 5377, 541, 55, A61P1/16, 31/20

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------|
| A | WO, 97/46237, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 1 1. 12月. 1997 (11. 12. 97) & CA, 2257296, A&AU, 9732128, A& EP, 906097, A1&CN, 1220601, A& BR, 9709528, A&JP, 2000-511899, A | 1-35, 38-43 |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

20.02.01

国際調査報告の発送日

06.03.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

4P

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| A | EP, 507650, A1 (SYNTHELABO S.A.), 7. 10月. 1992 (07. 10. 92) & FR, 2674855, A&CA, 2064924, A& NO, 9201281, A&AU, 9213989, A& CN, 1065459, A&JP, 5-112563, A& HU, 62573, A&US, 5280030, A | 1-35, 38-43 |
| A | WO, 97/25316, A1 (GLAXO GROUP LMT.), 17. 7月. 1997 (17. 07. 97) & AU, 9714389, A&NO, 9803089, A& CZ, 9802127, A&EP, 886635, A1 & BR, 9706938, A&HU, 9900580, A& US, 5998398, A&CN, 1212683, A& JP, 2000-503017, A&KR, 9907740, A& | 1-35, 38-43 |

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 36, 37 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。つまり、請求の範囲 36, 37 に記載された発明は人体の治療による処置方法に該当する。
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であって PCT 規則 6.4(a) の第 2 文及び第 3 文の規定に従って記載されていない。

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみにについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。

☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。